

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
18. April 2002 (18.04.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 02/30428 A1

(51) Internationale Patentklassifikation: A61K 31/4985, 31/519

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/11701

(22) Internationales Anmeldedatum:
10. Oktober 2001 (10.10.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 50 663.1 13. Oktober 2000 (13.10.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): GRÜNENTHAL GMBH [DE/DE]; Zieglerstraße 6,
52078 Aachen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SUNDERMANN,
Bernd [DE/DE]; Oppenhoffallee 83-85, 52066 Aachen
(DE). MAUL, Corinna [DE/DE]; Oppenhoffallee 83-85,
52066 Aachen (DE). HENNIES, Hagen-Heinrich
[DE/DE]; Eicherscheid 56, 52152 Simmerath (DE).
SCHNEIDER, Johannes [DE/DE]; Rolandstrasse 40,
52223 Stolberg (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,
MX, MZ, NO, NZ, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI,
SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU,
ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: USE OF SUBSTITUTED IMIDAZO[1,2-A]PYRIDINE-, IMIDAZO[1,2-A]PYRIMIDINE AND IMI-
DAZO[1,2-A]PYRAZINE-3-YL-AMINE DERIVATIVES FOR PRODUCING NOS-INHIBITING MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON SUBSTITUIERTEN IMIDAZO[1,2-A]PYRIDIN-, -PYRIMIDIN- UND -PYRA-
ZIN-3-YL-AMIN-DERIVATEN ZUR HERSTELLUNG VON MEDIKAMENTEN ZUR NOS-INHIBIERUNG

(57) Abstract: The invention relates to the use of the compounds of the general structure (I), or the pharmaceutically acceptable salts thereof, wherein X represents CR⁴ or N, Y represents CR⁵ or N, and X and Y are not simultaneously N, and W represents N or NR⁸. The novel compounds are used for producing a medicament for inhibiting NO synthase, for treating migraine and for treating septicemic shock, multiple sclerosis, Parkinson's disease, Alzheimer's disease, Huntington's chorea, inflammations, inflammatory pains, cerebral ischemia, diabetes, meningitis, arteriosclerosis and/or for wound healing.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Struktur I bzw. ihrer pharmazeutischen annehmbaren Salze (I), worin X CR⁴ oder N bedeutet, Y CR⁵ oder N bedeutet und X und Y nicht zugleich N bedeuten sowie W N oder NR⁸ bedeutet, zur Herstellung eines Medikaments zur Inhibierung der NO-Synthase, zur Behandlung von Migräne und zur Behandlung von septischem Schock, Multipler Sklerose, Morbus Parkinson, Morbus Alzheimer, Morbus Huntington, Entzündungen, Entzündungsschmerz, cerebraler Ischämie, Diabetes, Meningitis, Arteriosklerose und/oder für die Wundheilung.



WO 02/30428 A1

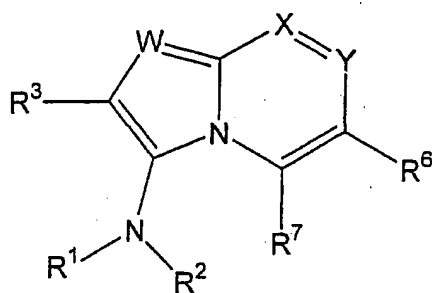
5 **Verwendung von substituierten Imidazo[1,2-a]pyridin-, -pyrimidin- und**
 -pyrazin-3-yl-amin-Derivaten zur Herstellung von Medikamenten zur
 NOS-Inhibierung

Die Erfindung betrifft die Verwendung von substituierten Imidazo[1,2-
a]pyridin-, -pyrimidin- und -pyrazin-3-yl-amin-Derivaten zur Herstellung von
10 Medikamenten zur NOS-Inhibierung, zur Herstellung von Medikamenten
zur Behandlung von Migräne sowie zur Herstellung von Medikamenten zur
Behandlung von septischem Schock, Multipler Sklerose, Morbus
Parkinson, Morbus Alzheimer, Morbus Huntington, Entzündungen,
Entzündungsschmerz, cerebraler Ischämie, Diabetes, Meningitis,
15 Arteriosklerose und/oder für die Wundheilung.

Stickstoffmonoxid (NO) reguliert zahlreiche physiologische Prozesse, unter
anderem die Neurotransmission, Relaxation und Proliferation von glatter
Muskulatur, die Adhäsion und Aggregation von Thrombozyten sowie die
20 Gewebeverletzung und Entzündung. Aufgrund der Vielzahl von
Signalfunktionen wird NO mit einer Reihe von Krankheiten in Verbindung
gebracht (s. z.B. L. J. Ignarro, *Angew. Chem.* (1999), 111, 2002-2013 und
F. Murad, *Angew. Chem. Int. Ed.* (1999), 111, 1976-1989). Eine wichtige
Rolle bei der therapeutischen Beeinflussung dieser Krankheiten spielt
25 dabei das für die physiologische Bildung von NO verantwortliche Enzym,
die NO-Synthase (NOS). Bislang wurden drei verschiedene Isoformen der
NO-Synthase, nämlich die beiden konstitutiven Formen nNOS und eNOS
sowie die induzierbare Form iNOS, identifiziert (s. A. J. Hobbs, A. Higgs, S.
Moncada, *Annu. Rev. Pharmacol. Toxicol.* (1999), 39, 191-220; I. C.
30 Green, P.-E. Chabrier, *DDT* (1999), 4, 47-49; P.-E. Chabrier et al., *Cell.*
Mol. Life Sci. (1999), 55, 1029-1035).

- Die Hemmung der NO-Synthase eröffnet neue Therapieansätze für verschiedene Krankheiten, die mit NO in Zusammenhang stehen (A. J. Hobbs et al., *Annu. Rev. Pharmacol. Toxicol.* (1999), 39, 191-220; I. C. Green, P.-E. Chabrier, *DDT* (1999), 4, 47-49; P.-E. Chabrier et al., *Cell. Mol. Life Sci.* (1999), 55, 1029-1035), wie beispielsweise Migräne (L. L. Thomsen, J. Olesen, *Clinical Neuroscience* (1998), 5, 28-33; L. H. Lassen et al., *The Lancet* (1997), 349, 401-402), septischer Schock, neurodegenerative Erkrankungen wie Multiple Sklerose, Morbus Parkinson, Morbus Alzheimer oder Morbus Huntington, Entzündungen, Entzündungsschmerz, cerebrale Ischämie, Diabetes, Meningitis und Arteriosklerose. Darüber hinaus kann die NOS-Inhibierung einen Effekt auf die Wundheilung, auf Tumoren und auf die Angiogenese haben sowie eine unspezifische Immunität gegen Microorganismen bewirken (A. J. Hobbs et al., *Annu. Rev. Pharmacol. Toxicol.* (1999), 39, 191-220).
- Bislang bekannte Wirkstoffe, die die NO-Synthase hemmen, sind neben L-NMMA und L-NAME – d.h. Analoga des L-Arginins, aus dem in-vivo unter Beteiligung von NOS NO und Citrullin gebildet werden - u.a. S-Methyl-L-citrullin, Aminoguanidin, S-Methylisoharnstoff, 7-Nitroindazol und 2-Mercaptoethylguanidin (A. J. Hobbs et al., *Annu. Rev. Pharmacol. Toxicol.* (1999), 39, 191-220).
- Der vorliegenden Erfindung lag demgegenüber die Aufgabe zugrunde, neue wirksame NOS-Inhibitoren zur Verfügung zu stellen.
- Überraschenderweise wurde gefunden, daß substituierte Imidazo[1,2-a]pyridin-, -pyrimidin- und -pyrazin-3-yl-amin-Derivate der allgemeinen Struktur I

3



I

worin

- X CR^4 oder N bedeutet,
 5 Y CR^5 oder N bedeutet und
 X und Y nicht zugleich N bedeuten,

 W N oder NR^8 bedeutet,

 10 R^1 C_{1-12} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und
 gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder
 mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder $\text{CH}_2\text{-C}_{3-8}$ -
 Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und
 unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist,
 15 Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist
 und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist,
 Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach
 substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert
 oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{1-8} -Alkyl-Aryl oder
 20 C_{1-8} -Alkyl-Heteroaryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt
 ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder
 ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein-
 oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert
 oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,

 25 R^2 Wasserstoff oder C(=O)R^9 bedeutet,

- R^3 C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-C₃₋₈-Cycloalkyl, C₁₋₈-Alkyl-Heterocyclyl, C₁₋₈-Alkyl-Aryl oder C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,
- R^4 , R^5 , R^6 und R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff oder C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder OH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert, oder ein- oder mehrfach substituiert ist, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, NH₂, C(=O)R⁹, CO₂H, CO₂R¹⁰, OH oder OR¹¹ bedeuten, oder
- R^4 und R^5 oder R^5 und R^6 oder R^6 und R^7 für eine viergliedrige gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffbrücke mit keinem, 1, 2 oder 3 Heteroatomen, die aus der Gruppe, die N,

O und S enthält, ausgewählt sind, stehen und die anderen Reste von R^4 , R^5 , R^6 und R^7 Wasserstoff bedeuten,

R^8 $C(=O)R^9$ bedeutet,

5

R^9 C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2 - C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{1-8} -Alkyl-Aryl oder C_{1-8} -Alkyl-Heteroaryl bedeutet, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet, und

10

15

20

R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2 - C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{1-8} -Alkyl-Aryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist

25

30

und Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeuten, sehr wirksame NOS-Inhibitoren darstellen.

- 5 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist daher die Verwendung der Verbindungen der wie oben definierten allgemeinen Struktur I in Form ihrer Basen oder ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze zur Herstellung eines Medikaments zur NO-Synthase-Inhibierung. Ferner ist die Verwendung einer Verbindung der allgemeinen Struktur I in Form ihrer
- 10 Base oder eines ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze zur Herstellung eines Medikaments zur Behandlung von Migräne sowie zur Behandlung von septischem Schock, Multipler Sklerose, Morbus Parkinson, Morbus Alzheimer, Morbus Huntington, Entzündungen, Entzündungsschmerz, cerebraler Ischämie, Diabetes, Meningitis, Arteriosklerose und/oder für die
- 15 Wundheilung Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

- Es ist bevorzugt, daß von den erfindungsgemäßen Verwendungen solche Verbindungen der allgemeinen Struktur I, in denen zugleich $R^1 = \text{tert.-Butyl}$, $R^2 = \text{H}$, $X = \text{CR}^4$ mit $R^4 = \text{H}$, $Y = \text{CR}^5$ mit $R^5 = \text{Methyl}$, $R^6 = \text{H}$ und $R^7 = \text{H}$
- 20 oder C_{1-4} -Alkanyl (wobei Alkanyl geradkettig oder verzweigt und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist), ausgenommen sind.

- Die Ausdrücke " C_{1-8} -Alkyl" und " C_{1-12} -Alkyl" umfassen im Sinne dieser Erfindung acyclische gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste,
- 25 die verzweigt- oder geradkettig sowie unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert sein können, mit 1 bis 8 bzw. 1 bis 12 C-Atomen, d.h. C_{1-8} -Alkanyle, C_{2-8} -Alkenyle und C_{2-8} -Alkinyle bzw. C_{1-12} -Alkanyle, C_{2-12} -Alkenyle und C_{2-12} -Alkinyle. Dabei weisen Alkenyle mindestens eine C-C-Doppelbindung und Alkinyle mindestens eine C-C-Dreifachbindung auf.
- 30 Vorteilhaft ist Alkyl aus der Gruppe ausgewählt, die Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, n-Pentyl, iso-Pentyl, neo-Pentyl, n-Hexyl, 2-Hexyl, n-Octyl, 1,1,3,3-Tetramethylbutyl, n-Decyl, n-

Dodecyl; Ethylenyl (Vinyl), Ethinyl, Propenyl ($-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_3$), Propinyl ($-\text{CH}-\text{C}\equiv\text{CH}$, $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_3$), Butenyl, Butinyl, Pentenyl, Pentinyl, Hexenyl, Hexinyl, Octenyl und Octinyl umfaßt.

- 5 Der Ausdruck "C₃₋₈-Cycloalkyl" bedeutet für die Zwecke dieser Erfindung cyclische Kohlenwasserstoffe mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, die gesättigt oder ungesättigt, unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert sein können. Vorteilhaft ist C₃₋₈-Cycloalkyl aus der Gruppe ausgewählt, die Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, 10 Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl und Cyclooctenyl enthält. Besonders bevorzugt steht Cycloalkyl für Cyclohexyl.

- Der Ausdruck "Heterocyclyl" steht für einen 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedrigen cyclischen organischen Rest, der mindestens 1, ggf. auch 2, 3, 4 oder 5 15 Heteroatome enthält, wobei die Heteroatome gleich oder verschieden sind und der cyclische Rest gesättigt oder ungesättigt, aber nicht aromatisch ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert sein kann. Der Heterocyclus kann auch Teil eines bi- oder polycyclischen Systems sein. Bevorzugte Heteroatome sind Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel. Es ist 20 bevorzugt, daß der Heterocyclyl-Rest ausgewählt ist aus der Gruppe, die Tetrahydrofuryl, Tetrahydropyryl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Piperazinyl und Morpholinyl enthält, wobei die Bindung an die Verbindung der allgemeinen Struktur I über jedes beliebige Ringglied des Heterocyclyl-Restes erfolgen kann.

- 25 Der Ausdruck "Aryl" bedeutet im Sinne dieser Erfindung aromatische Kohlenwasserstoffe, u.a. Phenyle, Naphthyle und Phenanthrenyle. Die Aryl-Reste können auch mit weiteren gesättigten, (partiell) ungesättigten oder aromatischen Ringsystemen kondensiert sein. Jeder Aryl-Rest kann 30 unsubstituiert oder einfach oder mehrfach substituiert vorliegen, wobei die Aryl-Substituenten gleich oder verschieden und in jeder beliebigen und möglichen Position des Aryls sein können. Vorteilhafterweise ist Aryl aus

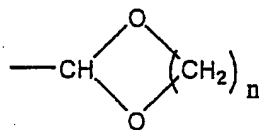
der Gruppe ausgewählt, die Phenyl, 1-Naphthyl, 2-Naphthyl und Phenanthren-9-yl, welche jeweils unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert sein können, enthält.

- 5 Der Ausdruck "Heteroaryl" steht für einen 5-, 6- oder 7-gliedrigen cyclischen aromatischen Rest, der mindestens 1, ggf. auch 2, 3, 4 oder 5 Heteroatome, enthält, wobei die Heteroatome gleich oder verschieden sind und der Heterocyclus unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert sein kann; im Falle der Substitution am Heterocyclus können die
- 10 Heteroarylsubstituenten gleich oder verschieden sein und in jeder beliebigen und möglichen Position des Heteroaryls sein. Der Heterocyclus kann auch Teil eines bi- oder polycyclischen Systems sein. Bevorzugte Heteroatome sind Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel. Es ist bevorzugt, daß der Heteroaryl-Rest ausgewählt ist aus der Gruppe, die Pyrrolyl,
- 15 Indolyl, Furyl (Furanyl), Benzofuranyl, Thienyl (Thiophenyl), Benzothienyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Pyridinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, Pyrazinyl, Pyranyl, Indolyl, Indazolyl, Purinyl, Pyrimidinyl, Indolizinyl, Chinolinyl, Isochinolinyl, Chinazolinyl, Carbazolyl, Phenazinyl, Phenothiazinyl enthält, wobei die Bindung an die Verbindungen der
- 20 allgemeinen Struktur I über jedes beliebige und mögliche Ringglied des Heteroaryl-Restes erfolgen kann. Besonders bevorzugte Heteroaryl-Reste sind für die Zwecke dieser Erfindung Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Furan-2-yl, Furan-3-yl, Thien-2-yl (2-Thiophen), Thien-3-yl (3-Thiophen) und Benzo[b]furan-2-yl, die jeweils unsubstituiert oder ein- oder mehrfach
- 25 substituiert sein können.

- Die Ausdrücke "C₁₋₈-Alkyl-C₃₋₈-Cycloalkyl" bzw. "CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl", "C₁₋₈-Alkyl-Heterocyclyl", "C₁₋₈-Alkyl-Aryl" oder "C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl" bedeuten für die Zwecke der vorliegenden Erfindung, daß C₁₋₈-Alkyl (bzw. CH₂) und
- 30 Cycloalkyl, Heterocyclyl, Aryl und Heteroaryl die oben definierten Bedeutungen haben und der Cycloalkyl-, Heterocyclyl-, Aryl- bzw. Heteroaryl-Rest über eine C₁₋₈-Alkyl-Gruppe (bzw. im Falle von "CH₂-C₃₋₈-

Cycloalkyl" über eine CH₂-Gruppe) an die Verbindung der allgemeinen Struktur I gebunden ist.

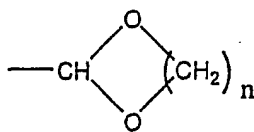
Im Zusammenhang mit "Alkyl", "Alkanyl", "Alkenyl" und "Alkinyl" versteht man unter dem Begriff "substituiert" im Sinne dieser Erfindung die Substitution eines Wasserstoffrestes durch F, Cl, Br, I, -CN, -N≡C, NH₂, NH-Alkyl, NH-Aryl, NH-Heteroaryl, NH-Alkyl-Aryl, NH-Alkyl-Heteroaryl, NH-Heterocyclyl, NH-Alkyl-OH, N(Alkyl)₂, N(Alkyl-Aryl)₂, N(Alkyl-Heteroaryl)₂, N(Heterocyclyl)₂, N(Alkyl-OH)₂, NO, NO₂, SH, S-Alkyl, S-Aryl, S-Heteroaryl, S-Alkyl-Aryl, S-Alkyl-Heteroaryl, S-Heterocyclyl, S-Alkyl-OH, S-Alkyl-SH, OH, O-Alkyl, O-Aryl, O-Heteroaryl, O-Alkyl-Aryl, O-Alkyl-Heteroaryl, O-Heterocyclyl, O-Alkyl-OH, CHO, C(=O)C₁₋₆-Alkyl, C(=S)C₁₋₆-Alkyl,



C(=O)Aryl, C(=S)Aryl, C(=O)C₁₋₆-Alkyl-Aryl, mit n = 1, 2 oder 3, C(=S)C₁₋₆-Alkyl-Aryl, C(=O)-Heteroaryl, C(=S)-Heteroaryl, C(=O)-Heterocyclyl, C(=S)-Heterocyclyl, CO₂H, CO₂-Alkyl, CO₂-Alkyl-Aryl, C(=O)NH₂, C(=O)NH-Alkyl, C(=O)NHAryl, C(=O)NH-Heterocyclyl, C(=O)N(Alkyl)₂, C(=O)N(Alkyl-Aryl)₂, C(=O)N(Alkyl-Heteroaryl)₂, C(=O)N(Heterocyclyl)₂, SO-Alkyl, SO₂-Alkyl, SO₂NH₂, SO₃H, PO(O-C₁₋₆-Alkyl)₂, Si(C₁₋₆-Alkyl)₃, Si(C₃₋₈-Cycloalkyl)₃, Si(CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl)₃, Si(Phenyl)₃, Cycloalkyl, Aryl, Heteroaryl oder Heterocyclyl, wobei unter mehrfach substituierten Resten solche Reste zu verstehen sind, die entweder an verschiedenen oder an gleichen Atomen mehrfach, z.B. zwei- oder dreifach, substituiert sind, beispielsweise dreifach am gleichen C-Atom wie im Falle von CF₃ oder -CH₂CF₃ oder an verschiedenen Stellen wie im Falle von -CH(OH)-CH=CH-CHCl₂. Die Mehrfachsubstitution kann mit dem gleichen oder mit verschiedenen Substituenten erfolgen. Ggf. kann ein Substituent auch seinerseits substituiert sein; so umfaßt -OAlkyl u.a. auch -O-CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂-OH. Besonders bevorzugt für die Zwecke der vorliegenden Erfindung bedeutet "Alkyl" in diesem Zusammenhang Methyl, Ethyl, CH₂-OH, CH₂CO₂H, CH₂CO₂Methyl,

$\text{CH}_2\text{PO}(\text{O}-\text{C}_{1-6}\text{-Alkanyl})_2$, $\text{CH}_2\text{Si}(\text{C}_{1-6}\text{-Alkanyl})_3$, $\text{CH}_2\text{Si}(\text{C}_{3-8}\text{-Cycloalkyl})_3$,
 $\text{CH}_2\text{Si}(\text{CH}_2\text{-C}_{3-8}\text{-Cycloalkyl})_3$, $\text{CH}_2\text{Si}(\text{Phenyl})_3$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-Morpholin-4-yl}$, $\text{CH}_2\text{-}$
 Aryl, CF_3 oder $(\text{CH}_2)_n\text{-N}\equiv\text{C}$ mit $n = 2, 3, 4, 5$ oder insbesondere 6.

- 5 In Bezug auf "Aryl", "Heterocyclyl", "Heteroaryl" sowie "Cycloalkyl" versteht
 man im Sinne dieser Erfindung unter "ein- oder mehrfach substituiert" die
 ein- oder mehrfache, z.B. zwei-, drei- oder vierfache, Substitution eines
 oder mehrerer Wasserstoffatome des Ringsystems durch F, Cl, Br, I, CN,
 NH_2 , NH-Alkyl, NH-Aryl, NH-Heteroaryl, NH-Alkyl-Aryl, NH-Alkyl-Heteroaryl,
 10 NH-Heterocyclyl, NH-Alkyl-OH, $\text{N}(\text{Alkyl})_2$, $\text{N}(\text{Alkyl-Aryl})_2$, $\text{N}(\text{Alkyl-}$
 Heteroaryl) $_2$, $\text{N}(\text{Heterocyclyl})_2$, $\text{N}(\text{Alkyl-OH})_2$, NO, NO_2 , SH, S-Alkyl, S-
 Cycloalkyl, S-Aryl, S-Heteroaryl, S-Alkyl-Aryl, S-Alkyl-Heteroaryl, S-
 Heterocyclyl, S-Alkyl-OH, S-Alkyl-SH, OH, O-Alkyl, O-Cycloalkyl, O-Aryl, O-
 Heteroaryl, O-Alkyl-Aryl, O-Alkyl-Heteroaryl, O-Heterocyclyl, O-Alkyl-OH,
 15 CHO, $\text{C}(=\text{O})\text{C}_{1-6}\text{-Alkyl}$, $\text{C}(=\text{S})\text{C}_{1-6}\text{-Alkyl}$, $\text{C}(=\text{O})\text{Aryl}$, $\text{C}(=\text{S})\text{Aryl}$, $\text{C}(=\text{O})\text{-C}_{1-6}\text{-}$



- Alkyl-Aryl, mit $n = 1, 2$ oder 3, $\text{C}(=\text{S})\text{C}_{1-6}\text{-Alkyl-Aryl}$,
 $\text{C}(=\text{O})\text{-Heteroaryl}$, $\text{C}(=\text{S})\text{-Heteroaryl}$, $\text{C}(=\text{O})\text{-Heterocyclyl}$, $\text{C}(=\text{S})\text{-}$
 Heterocyclyl, CO_2H , $\text{CO}_2\text{-Alkyl}$, $\text{CO}_2\text{-Alkyl-Aryl}$, $\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$, $\text{C}(=\text{O})\text{NH-Alkyl}$,
 $\text{C}(=\text{O})\text{NHAryl}$, $\text{C}(=\text{O})\text{NH-Heterocyclyl}$, $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{Alkyl})_2$, $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{Alkyl-Aryl})_2$,
 20 $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{Alkyl-Heteroaryl})_2$, $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{Heterocyclyl})_2$, S(O)-Alkyl, S(O)-Aryl,
 $\text{SO}_2\text{-Alkyl}$, $\text{SO}_2\text{-Aryl}$, SO_2NH_2 , SO_3H , CF_3 , =O, =S; Alkyl, Cycloalkyl, Aryl,
 Heteroaryl und/oder Heterocyclyl; an einem oder ggf. verschiedenen
 Atomen (wobei ein Substituent ggf. seinerseits substituiert sein kann). Die
 Mehrfachsubstitution erfolgt dabei mit dem gleichen oder mit
 25 unterschiedlichen Substituenten. Für "Aryl" sind dabei besonders
 bevorzugte Substituenten -F, -Cl, -Br, - CF_3 , -OH, -O- CH_3 , -O- CH_2CH_3 ,
 Methyl, n-Propyl, Carboxy ($-\text{CO}_2\text{H}$), Nitro, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy und
 Dimethylamino. Für "Heteroaryl" sind besonders bevorzugte Substituenten
 Methyl-OH, -O- CH_3 , - CH_2OH , - NO_2 , - CO_2H , - CO_2Ethyl , Acetoxymethyl, -Br,
 30 -Cl, -Methylsulfanyl ($-\text{S-CH}_3$), Nitrophenyl, Chlorphenyl und -[1,3]-Dioxolan.

Für "Cycloalkyl" sind besonders bevorzugte Substituenten CO₂H und CO₂Ethyl. Für "Heterocyclyl" sind bevorzugte Substituenten Methyl und Ethyl.

- 5 Pharmazeutisch annehmbare Salze im Sinne dieser Erfindung sind solche Salze der erfindungsgemäßen Verbindungen gemäß der allgemeinen Struktur I, die bei pharmazeutischer Verwendung physiologisch – insbesondere bei Anwendung am Säugetier und/oder Menschen –
10 verträglich sind. Solche pharmazeutisch annehmbaren Salze können beispielsweise mit anorganischen oder organischen Säuren gebildet werden.

- Vorzugsweise werden die pharmazeutisch annehmbaren Salze der erfindungsgemäßen Verbindungen gemäß der allgemeinen Struktur I mit
15 Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Methansulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Kohlensäure, Ameisensäure, Essigsäure, Oxalsäure, Bernsteinsäure, Weinsäure, Mandelsäure, Fumarsäure, Milchsäure, Citronensäure, Glutaminsäure oder Asparaginsäure gebildet. Bei den gebildeten Salzen handelt es sich u.a.
20 um Hydrochloride, Hydrobromide, Phosphate, Carbonate, Hydrogencarbonate, Formiate, Acetate, Oxalate, Succinate, Tartrate, Fumarate, Citrate und Glutamate. Ebenfalls bevorzugt sind Solvate und insbesondere die Hydrate der erfindungsgemäßen Verbindungen, die z.B. durch Kristallisation aus wäßriger Lösung erhalten werden können.

- 25 Sofern die Verbindungen der allgemeinen Struktur I mindestens ein Asymmetriezentrum aufweisen, können sie in Form ihrer Racemate, in Form der reinen Enantiomeren und/oder Diastereomeren oder in Form von Mischungen dieser Enantiomeren bzw. Diastereomeren vorliegen, und
30 zwar sowohl in Substanz als auch als pharmazeutisch annehmbare Salze dieser Verbindungen. Die Mischungen können in jedem beliebigen Mischungsverhältnis der Stereoisomeren vorliegen. Chirale Verbindungen

der allgemeinen Struktur I liegen bevorzugt als enantiomerenreine Verbindungen vor.

- Es ist bevorzugt, solche Verbindungen der allgemeinen Struktur I (in Form ihrer Basen oder ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze) für die erfindungsgemäße Herstellung eines Medikaments zur NOS-Inhibierung, zur Behandlung von Migräne bzw. zur Behandlung von septischem Schock, Multipler Sklerose, Morbus Parkinson, Morbus Alzheimer, Morbus Huntington, Entzündungen, Entzündungsschmerz, cerebraler Ischämie, Diabetes, Meningitis, Arteriosklerose und/oder für die Wundheilung zu verwenden, in denen
- R^1 Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, n-Hexyl, n-Octyl, 1,1,3,3-Tetramethylbutyl, CH_2Aryl , wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, $CH_2CO_2-C_{1-6}$ -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist, $CH_2PO(O-C_{1-6}-Alkyl)_2$, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist, $CH_2SiR^{12}R^{13}R^{14}$, CH_2CH_2 -Morpholin-4-yl, $(CH_2)_n-NC$ mit $n = 2, 3, 4, 5$ oder 6 , C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, oder Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,
- R^2 H oder $C(=O)-C_{1-4}$ -Alkyl bedeutet,
- R^3 Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, die unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert sind, Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, 1-Naphthyl oder 2-Naphthyl, wobei Naphthyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, 9-Phenanthrenyl, Pyrrol-2-yl, Pyrrol-3-yl, Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl oder Pyridin-4-yl, wobei Pyrrolyl oder Pyridinyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert sind, Furan-2-yl oder Furan-3-yl, wobei Furanyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Thien-2-yl oder Thien-3-yl, wobei Thienyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Imidazol-2-yl, Imidazol-4-yl, Imidazol-5-yl, wobei

- Imidazolyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Thiazol-2-yl, Thiazol-4-yl, Thiazol-5-yl, wobei Thiazolyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Oxazol-2-yl, Oxazol-4-yl, Oxazol-5-yl, wobei Oxazolyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Isooxazol-3-yl, Isooxazol-4-yl, Isooxazol-5-yl, wobei Isooxazolyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Indol-2-yl, Benzofuran-2-yl oder Benzofuran-3-yl bedeuten,
- 5 R^4 , R^5 , R^6 und R^7 unabhängig voneinander H, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, CF_3 , F, Cl, Br, I, CO_2H , CO_2 Methyl, CO_2 Ethyl, $C(=O)CH_3$ oder NO_2 bedeuten oder R^6 und R^7 die Kohlenwasserstoffbrücke $-CH=CH-CH=CH-$ bilden,
- 10 R^8 $C(=O)CH_3$ bedeutet, und R^{12} , R^{13} und R^{14} unabhängig voneinander C_{1-6} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2-C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, oder Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeuten.
- 15 Weiter bevorzugt ist die erfindungsgemäße Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Struktur I, in denen
- 20 R^1 Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, n-Hexyl, n-Octyl, 1,1,3,3-Tetramethylbutyl, CH_2 Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, $CH_2CO_2-C_{1-6}$ -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist, $CH_2PO(O-C_{1-6}-Alkyl)_2$, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist, $CH_2SiR^{12}R^{13}R^{14}$, CH_2CH_2 -Morpholin-4-yl, $(CH_2)_n-NC$ mit $n = 2, 3, 4, 5$ oder 6, C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, oder Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,
- 25 R^2 H oder $C(=O)-C_{1-4}$ -Alkyl bedeutet,
- 30 R^3 Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, die unabhängig voneinander

unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituier sind, Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino substituiert ist, 1-Naphthyl oder 2-Naphthyl, wobei Naphthyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino substituiert ist, 9-Phenanthrenyl, Pyrrol-2-yl, Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl oder Pyridin-4-yl, wobei Pyridinyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino, Carboxy, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Hydroxymethyl, Chlorphenyl, Nitrophenyl, [1,3]-Dioxolan, Methylsulfanyl substituiert ist, Furan-2-yl oder Furan-3-yl, wobei Furanyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino, Carboxy, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Hydroxymethyl, Chlorphenyl, Nitrophenyl, [1,3]-Dioxolan, Methylsulfanyl substituiert ist, Thien-2-yl oder Thien-3-yl, wobei Thienyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino, Carboxy, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Hydroxymethyl, Chlorphenyl, Nitrophenyl, [1,3]-Dioxolan, Methylsulfanyl substituiert ist, Indol-2-yl, Benzofuran-2-yl oder Benzofuran-3-yl bedeuten,

R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander H, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, CF₃, F, Cl, Br, I, CO₂H, CO₂Methyl,

CO₂Ethyl, C(=O)CH₃ oder NO₂ bedeuten oder R⁶ und R⁷ die Kohlenwasserstoffbrücke -CH=CH-CH=CH- bilden,

R⁸ C(=O)CH₃ bedeutet, und

R¹², R¹³ und R¹⁴ unabhängig voneinander C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl

5 geradkettig oder verzweigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, oder Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeuten.

10

Besonders bevorzugt ist die erfindungsgemäße Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Struktur I, in denen

R¹ Methyl, n-Butyl, 1,1,3,3-Tetramethylbutyl, Benzyl, 2-Chlorbenzyl, 2-Methoxybenzyl, CH₂CO₂CH₃, (CH₂)₆-NC, Cyclopentyl, Cyclohexyl,
15 Phenyl, 2,6-Dimethylphenyl, 3-Chlorphenyl oder 3-Chlor-4-fluorphenyl bedeutet,

R² H oder C(=O)CH₃ bedeutet,

R³ Methyl, tert-Butyl, Cyclohexyl, Phenyl, 2-Methylphenyl, 3-Methylphenyl, 4-Methylphenyl, 2-Trifluormethylphenyl, 3-Trifluormethylphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 2-Hydroxyphenyl, 2-Methoxyphenyl, 3-Hydroxyphenyl, 3-Methoxyphenyl, 2-Fluorphenyl, 3-Fluorphenyl, 4-Fluorphenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, 2-Bromphenyl, 3-Bromphenyl, 4-Bromphenyl, 2-Nitrophenyl, 3-Nitrophenyl, 4-Nitrophenyl, 3-(4-Chlorphenoxy)-phenyl,
20 2,4-Dimethylphenyl, 2,3-Dimethoxyphenyl, 3,4-Dimethoxyphenyl, 3-Methoxy-4-acetoxyphenyl, 2,3-Dichlorphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 2-Chlor-4-fluorphenyl, 2-Chlor-6-fluorphenyl, 4-Brom-2-fluorphenyl, 3,4,5-Trimethoxyphenyl, 1-Naphthyl, 2-Ethoxy-naphth-1-yl, 4-Dimethylamino-naphth-1-yl, 9-Phenanthrenyl, Pyrrol-2-yl, N-Methylpyrrol-2-yl, Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, Furan-2-yl,
25 Furan-3-yl, 5-Methyl-furan-2-yl, 4,5-Dimethyl-furan-2-yl, 5-Hydroxymethyl-furan-2-yl, 5-Acetoxy-methyl-furan-2-yl, 5-Carboxy-

30

5 furan-2-yl, 5-[1,3]-Dioxolan-furan-2-yl, 3-Brom-furan-2-yl, 5-Brom-furan-2-yl, 5-Nitro-furan-2-yl, 5-(2-Nitrophenyl)-furan-2-yl, 5-(2-Chlorphenyl)-furan-2-yl, 5-(3-Chlorphenyl)-furan-2-yl, 5-(3-Chlorphenyl)-furan-3-yl, 5-(4-Chlorphenyl)-furan-2-yl, Benzo[b]furan-2-yl, Thien-2-yl, Thien-3-yl, 5-Methyl-thien-2-yl, 5-Carboxy-thien-2-yl, 3-Brom-thien-2-yl, 5-Chlor-thien-2-yl oder 5-Methylsulfanyl-thien-2-yl bedeutet,

R^4 H, CH_3 , Cl, Br oder CO_2H bedeutet,

R^5 H, CH_3 , C_2H_5 oder Cl bedeutet,

10 R^6 H, CH_3 , Cl, Br oder NO_2 ,

R^7 H, CH_3 oder $n-C_3H_7$ bedeutet und

R^8 $C(=O)CH_3$ bedeutet.

15 Ganz besonders bevorzugt ist dabei die Verwendung von Verbindungen, in denen R^4 und R^6 H bedeuten, R^5 H, CH_3 oder C_2H_5 bedeutet und R^7 H oder CH_3 bedeutet.

Vorzugsweise sind die Verbindungen der allgemeinen Struktur I (in Form ihrer Basen oder ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze), die für die

20 erfindungsgemäße Herstellung eines Medikaments zur NOS-Inhibierung, zur Behandlung von Migräne bzw. zur Behandlung von septischem Schock, Multipler Sklerose, Morbus Parkinson, Morbus Alzheimer, Morbus Huntington, Entzündungen, Entzündungsschmerz, cerebraler Ischämie, Diabetes, Meningitis, Arteriosklerose und/oder für die Wundheilung zu

25 verwendet werden, aus der Gruppe ausgewählt, die enthält:

tert-Butyl-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,

Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,

(5,7-Dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-amin,

30 {6-[5,7-Dimethyl-2-(1H-pyrrol-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,

- tert*-Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
 [2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
- 5 Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin;
 (2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
 (1,1,3,3-Tetramethyl-butyl)-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 Cyclohexyl-(7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
- 10 Cyclohexyl-(7-methyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 (5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
 Cyclohexyl-[7-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
- 15 *tert*-Butyl-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 (7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
 Cyclohexyl-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 [2-(2-Fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-
- 20 tetramethyl-butyl)-amin,
 (2,7-Dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-essigsäuremethylester,
 Methylidyne-[6-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
 3-(3-*tert*-Butylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol,
- 25 Cyclohexyl-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
tert-Butyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 3-(3-*tert*-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol,
tert-Butyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
- 30 Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,

- (2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
(7-Methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
5 Butyl-(2-cyclohexyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
3-[5,7-Dimethyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-phenol,
(2,6-Dimethyl-phenyl)-(5,7-dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
10 *tert*-Butyl-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-fluor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
Cyclohexyl-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
[5,7-Dimethyl-2-(1H-pyrrol-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
15 Butyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(5,7-Dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
20 (2,7-Dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
25 (2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
30 [6-(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methyldiyne-ammonium,

- (7-Methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
5 [2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-
10 ammonium,
tert-Butyl-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
Essigsäure 5-(3-cyclohexylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-ylmethylester,
15 [2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
3-(3-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol,
20 (2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
Essigsäure 5-(3-cyclohexylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-
25 furan-2-ylmethylester,
[6-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,
Butyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
{6-[2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-
30 hexyl}-methylidyne-ammonium,
{5-[5,7-Dimethyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-yl}-methanol,

- (7-Methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
 [5-(3-*tert*-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-yl]-
 methanol,
- 5 *tert*-Butyl-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
 (2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
 5-(3-*tert*-Butylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-
- 10 carbonsäure,
tert-Butyl-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 Cyclohexyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 [2-(2,3-Dichlorphenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
- 15 (7-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
 (2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
 3-(3-Butylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol,
- 20 Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
 {6-[5,7-Dimethyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methyldiyne-ammonium,
tert-Butyl-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
 Cyclohexyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
- 25 [2-(2,3-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
 (2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
 {2-[5-(2-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
- 30 (1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
 5-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure,

- Cyclohexyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
3-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-phenol,
5 [2-(2,3-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,4-Dichlorphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(5-Bromfuran-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
10 5-(3-Cyclohexylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-carbonsäure,
[6-(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,
15 [2-(2,4-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
5-(3-Cyclohexylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-carbonsäure,
20 {6-[2-(2-Bromphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
tert-Butyl-(2-cyclohexyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
tert-Butyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
25 (5,7-Dimethyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,3-Dichlorphenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
30 {2-[5-(3-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,

- Cyclohexyl-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
[2-(2-Bromphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-cyclohexyl-amin,
[2-(2-Methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
5 {5-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-
furan-2-yl}-methanol.
(6-[2-[5-(2-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-
ylamino]-hexyl)-methylidyne-ammonium,
Cyclohexyl-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
10 amin,
Cyclohexyl-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
amin,
[6-(5,7-Dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-
methylidyne-ammonium,
15 Methylidyne-[6-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-
hexyl]-ammonium,
[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
{6-[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-
20 hexyl}-methylidyne-ammonium,
5-(3-*tert*-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-thiophen-2-
carbonsäure,
Cyclohexyl-(8-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-
25 tetramethyl-butyl)-amin,
5-(3-Butylamino-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure,
Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(2-Benzofuran-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
30 {6-[2-(2-Fluor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-
methylidyne-ammonium,

- [2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-phenanthren-9-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
- 5 5-(3-*tert*-Butylamino-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure,
tert-Butyl-(8-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
- 10 *tert*-Butyl-(2-cyclohexyl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(6-Methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
tert-Butyl-(6-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-
- 15 butyl)-amin,
5-(3-*tert*-Butylamino-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure,
[6-(5,7-Dimethyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,
- 20 3-[3-(2,6-Dimethyl-phenylamino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-phenol,
(2,6-Dimethyl-phenyl)-(8-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
{6-[2-(3-Hydroxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
- 25 {5-[3-(2,6-Dimethyl-phenylamino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-furan-2-yl}-methanol,
(8-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,4-Dichlorphenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-
- 30 phenyl)-amin,
Butyl-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,

- Butyl-[2-(4-dimethylamino-naphthalen-1-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-amin,
{6-[2-(2-Brom-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-
methyliidyne-ammonium,
- 5 Butyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
(2-Cyclohexyl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-
butyl)-amin,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
- 10 (2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-
essigsäuremethylester,
N-(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 15 N-*tert*-Butyl-N-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
acetamid
N-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-
20 tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(5,7-dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-
yl)-acetamid,
N-(2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-
butyl)-acetamid,
- 25 N-(1,1,3,3-Tetramethyl-butyl)-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
acetamid,
N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 30 5-[3-(Acetyl-*tert*-butyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl]-thiophen-2-
carbonsäure,

- 5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure,
N-[2-(5-Hydroxymethyl-furan-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
5 N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-
dimethyl-phenyl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
acetamid,
Essigsäure 5-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-
10 a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethyl ester,
{6-[Acetyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-
hexyl}-methylidyne-ammonium,
N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-
dimethyl-phenyl)-acetamid,
15 N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-
acetamid,
N-(5,7-Dimethyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-
butyl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
20 acetamid,
N-Cyclohexyl-N-[7-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-
3-yl]-acetamid,
N-(6,8-Dibrom-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-acetamid,
25 N-(7-Methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-
butyl)-acetamid,
Essigsäure-5-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-
2-yl]-furan-2-ylmethylester,
N-(7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-
30 butyl)-acetamid,
N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-
dimethyl-phenyl)-acetamid,

- N-Cyclohexyl-N-[5,7-dimethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 N-Butyl-N-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 5 N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
 N-Cyclohexyl-N-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 [Acetyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-
 10 essigsäuremethylester,
 N-Cyclohexyl-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
 5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-thiophen-2-carbonsäure,
 N-[2-(2,4-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-
 15 (1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
 N-Cyclohexyl-N-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 N-(2-*tert*-Butyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
 20 N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 N-[2-(3-Hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-fluor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-
 25 a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 5-{3-(Acetyl-*tert*-butyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-thiophen-2-carbonsäure,
 N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 30 N-(7-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,

- 5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-furan-2-carbonsäure,
N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 5 N-[2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 10 N-*tert*-Butyl-N-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- 15 N-[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-[2-[3-(4-chlor-phenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
N-[2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-
- 20 (1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
5-[3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure,
N-*tert*-Butyl-N-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- 25 N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-[2-(5-Methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
5-[3-(Acetyl-*tert*-butyl-amino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-
- 30 carbonsäure,
N-[2-(4,5-Dimethyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,

- N-Cyclohexyl-N-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- N-*tert*-Butyl-N-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 5 5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl}-thiophen-2-carbonsäure,
- N-Butyl-N-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-acetamid,
- N-[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
- 10 N-*tert*-Butyl-N-(7-methyl-2-phenanthren-9-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- 15 N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- N-(2-*tert*-Butyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
- 20 Essigsäure-4-{3-[acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-6-brom-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-2-methoxy-phenylester,
- N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- [6-(Acetyl-{7-methyl-2-[5-(2-nitro-phenyl)-furan-2-yl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,
- 25 N-(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- N-(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- 30 5-[3-(Acetyl-*tert*-butyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure,

- N-(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
5 N-[2-(4,5-Dimethyl-furan-2-yl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-Butyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-
10 cyclohexyl-acetamid,
5-{3-[Acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-thiophen-2-carbonsäure,
N-Butyl-N-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
15 N-*tert*-Butyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-(2-Furan-2-yl-5-propyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
5-{3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-thiophen-2-carbonsäure,
20 5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-furan-2-carbonsäure,
3-(Acetyl-butyl-amino)-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-8-carbonsäure,
{6-[Acetyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methyldiyne-ammonium,
25 N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-acetamid,
5-{3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-thiophen-2-carbonsäure,
N-[2-(5-Methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
30 N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,

- N-Butyl-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 (6-{Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-6-nitro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino}-
 hexyl)-methylidyne-ammonium,
 N-(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-
 5 phenyl)-acetamid,
 (6-{Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
 amino}-hexyl)-methylidyne-ammonium,
 {6-[Acetyl-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-
 methylidyne-ammonium,
 10 N-(6-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-
 butyl)-acetamid,
 Essigsäure-5-{3-[acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-5,7-dimethyl-
 imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-furan-2-ylmethylester,
 {Acetyl-[2-(3-hydroxy-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino}-
 15 essigsäuremethylester,
 N-*tert*-Butyl-N-[2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
 acetamid,
 N-Butyl-N-[2-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 N-[2-(2,4-Dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-
 20 phenyl)-acetamid,
 5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-7-methyl-imidazo[1,2-
 a]pyrimidin-2-yl}-furan-2-carbonsäure,
 Essigsäure-5-{3-[acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-
 a]pyrimidin-2-yl}-furan-2-ylmethylester,
 25 N-(2,7-Dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-
 acetamid,
 Essigsäure-4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5-amino-7-chlor-imidazo[1,2-
 a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenylester,
 Essigsäure-4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-
 30 a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenylester,
 N-[6-Brom-2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-
 cyclohexyl-acetamid,

- N-[2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid,
N-Butyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
N-[2-(5-chlor-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-N-(1,1,3,3-
5 tetramethyl-butyl)-acetamid,
[Acetyl-(2-cyclohexyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-essigsäuremethylester,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
10 N-Cyclohexyl-N-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
Essigsäure-5-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethylester,
N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[6-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-
15 imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-5-methyl-imidazo[1,2-
20 a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(5-propyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-methyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-
25 a]pyridin-8-carbonsäure,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-{2-[3-(4-chlor-phenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-N-cyclohexyl-acetamid,
30 Essigsäure-4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenylester,

- N-[2-(5-Brom-furan-2-yl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
- 5 N-Cyclohexyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 N-Cyclohexyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
 N-Cyclohexyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
- 10 [Acetyl-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl)-amino]-essigsäuremethylester,
 N-*tert*-Butyl-N-(6,8-dichlor-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
 N-*tert*-Butyl-N-(5-propyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 15 {6-[Acetyl-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
 N-Butyl-N-(6-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
 (6-[Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino]-hexyl)-methylidyne-ammonium,
- 20 5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-furan-2-carbonsäure,
 N-Butyl-N-[2-(3,4,5-trimethoxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-acetamid,
 N-Butyl-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
- 25 [Acetyl-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-amino]-essigsäuremethylester,
 N-(2-Benzofuran-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
 N-Butyl-N-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-acetamid,
- 30 N-*tert*-Butyl-N-(6,8-dibrom-2-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
 {6-[Acetyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,

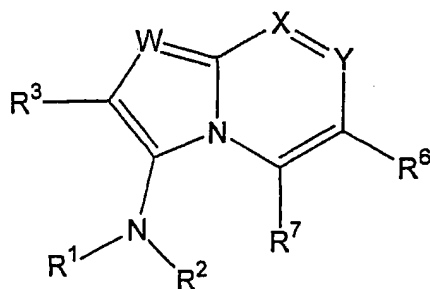
- N-*tert*-Butyl-N-[2-(2-ethoxy-naphthalen-1-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- 5 Cyclohexyl-[7-methyl-2-(2-trifluoromethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin-Hydrochlorid,
tert-Butyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
tert-Butyl-(7-methyl-2-phenyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
- 10 Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
tert-Butyl-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid
- 15 [2-(2-Fluorphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-phenyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
(2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
- 20 *tert*-Butyl-[2-(4-nitro-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-amin-Hydrochlorid,
N-[2-[3-(4-Chlorphenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid-Hydrochlorid,
N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid-
- 25 Hydrochlorid,
N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2,4-dimethyl-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid-Hydrochlorid,
1-Acetyl-3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-1-ium-Chlorid-Hydrochlorid,
- 30 Cyclohexyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,

- Cyclopentyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
[2-(4-Bromo-2-fluoro-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
cyclopentyl-amin-Hydrochlorid,
- 5 Cyclopentyl-{5,7-dimethyl-2-[5-(2-nitro-phenyl)-furan-2-yl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amin-Hydrochlorid,
{2-[5-(4-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-
cyclopentyl-amin-Hydrochlorid,
- Cyclopentyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-
10 Hydrochlorid,
(2-Furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-
butyl)-amin-Hydrochlorid,
Benzyl-(7-methyl-2-thiophen-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-
Hydrochlorid,
- 15 Cyclohexyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-
Hydrochlorid,
(2-Furan-3-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-
butyl)-amin-Hydrochlorid
(5,7-Dimethyl-2-thiophen-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-
20 tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
[7-Ethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2-methoxy-
benzyl)-amin,
(2-Chlorbenzyl)-[7-ethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
amin,
- 25 [7-Ethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2-methoxy-
benzyl)-amin,
(2-Chlorbenzyl)-(7-ethyl-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(3-Chlor-4-fluorphenyl)-[7-ethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-
a]pyridin-3-yl]-amin,
- 30 (2-Benzofuran-2-yl-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(3-chlor-4-
fluorphenyl)-amin,
(2-Benzofuran-2-yl-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(3-chlorphenyl)-amin,

- (3-Chlor-4-fluorphenyl)-{2-[5-(3-chloro-phenyl)-furan-2-yl]-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amin,
 (3-Chlor-4-fluorphenyl)-{2-[5-(2-chlorophenyl)-furan-2-yl]-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amin,
 5 (3-Chlor-4-fluorphenyl)-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin.

Die erfindungsgemäß verwendeten Verbindungen der allgemeinen Struktur

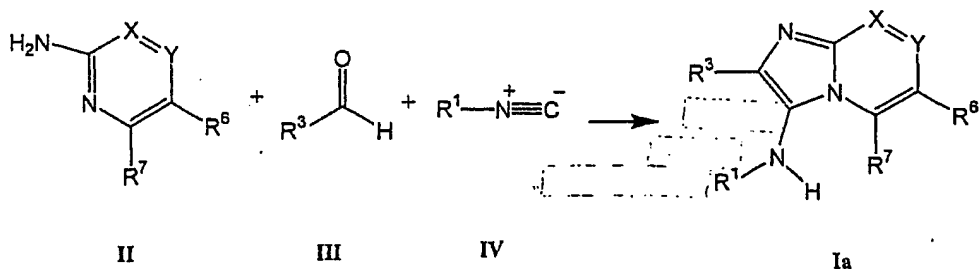
I



10

in denen R^2 für Wasserstoff steht, W für N steht und R^1 , R^3 , R^6 , R^7 , X und Y die oben angegebenen Bedeutungen haben, d.h. Verbindungen der allgemeinen Struktur Ia, können gemäß folgender Reaktionsgleichung

15 hergestellt werden:



Dabei wird ein Amidin der allgemeinen Struktur II, d.h. ein Aminopyridin ($X = CR^4$ und $Y = CR^5$) oder ein Aminopyrimidin ($X = N$ und $Y = CR^5$) oder ein Aminopyrazin ($X = CR^4$ und $Y = N$), wobei die Reste R^4 bis R^7 wie für die Verbindung der allgemeinen Struktur I definiert sind, mit einem Aldehyd der allgemeinen Struktur III, wobei R^3 wie für die Verbindung der allgemeinen Struktur I definiert ist, und einem Isonitril der allgemeinen Formel IV, wobei

20

R¹ wie für die Verbindung der allgemeinen Struktur I definiert ist, unter geeigneten Reaktionsbedingungen umgesetzt. Vorzugsweise wird die Reaktion in Gegenwart einer geringen Menge einer Säure, insbesondere 20 %ige wäßrige Perchlorsäure, in einer Dreikomponenten-Eintopf-
5 Umsetzung durchgeführt, die auch semi- oder vollautomatisiert parallelsynthetisch erfolgen kann. Bevorzugt wird die Reaktion in einem organischen Lösungsmittel, insbesondere Dichlormethan oder Acetonitril, bei einer Temperatur von vorzugsweise 0 °C bis 80 °C, insbesondere 15 °C bis 30 °C durchgeführt.

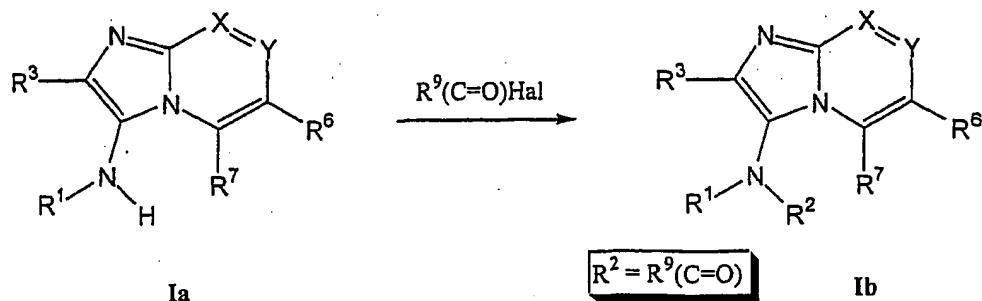
10

Die Ausgangsverbindungen der allgemeinen Strukturen II, III und IV sind kommerziell erhältlich (z.B. von den Firmen Acros, Geel; Avocado, Port of Heysham; Aldrich, Deisenhofen; Fluka, Seelze; Lancaster, Mülheim; Maybridge, Tintagel; Merck, Darmstadt; Sigma, Deisenhofen; TCI, Japan)
15 und/oder nach im Stand der Technik bekannten Verfahren ohne weiteres zugänglich.

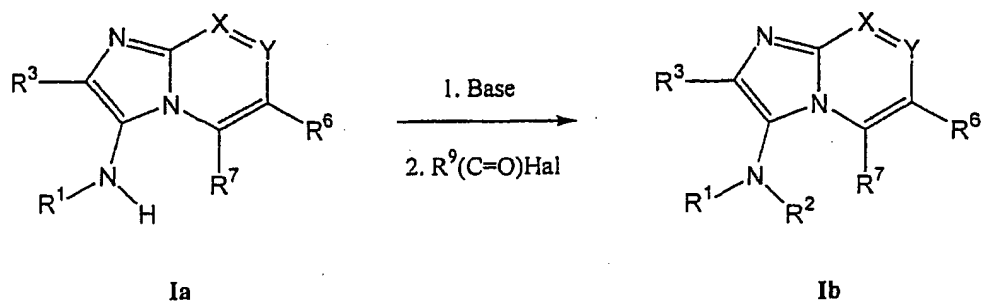
Zur Herstellung der erfindungsgemäß verwendeten Verbindungen der allgemeinen Formel I, bei denen R² nicht Wasserstoff, sondern C(=O)R⁹ bedeutet, können die Verbindungen der allgemeinen Struktur, bei denen R² H bedeutet (d.h. Verbindungen der allgemeinen Formel Ia), entweder ohne Lösungsmittel oder in einem polaren oder unpolaren aprotischen Lösungsmittel, beispielsweise Dimethylsulfoxid (DMSO), Dimethylformamid (DMF), Halogenkohlenwasserstoffen wie beispielsweise Dichlormethan,
20 Acetonitril, aliphatischen Ethern wie Tetrahydrofuran (THF) oder 1,4-Dioxan oder in Kohlenwasserstoffen oder in Gemischen dieser Lösungsmittel, je nach gewünschtem Endprodukt mit einem Säurehalogenid R⁹COHal, worin Hal für Fluor, Chlor, Brom oder Iod steht und R⁹ wie oben für die Verbindung der allgemeinen Struktur I definiert ist,
25 innerhalb von z.B. 0,25 bis 12 Stunden bei Temperaturen zwischen 0°C und 160°C gemäß dem folgenden Reaktionsschema umgesetzt werden:

30

37

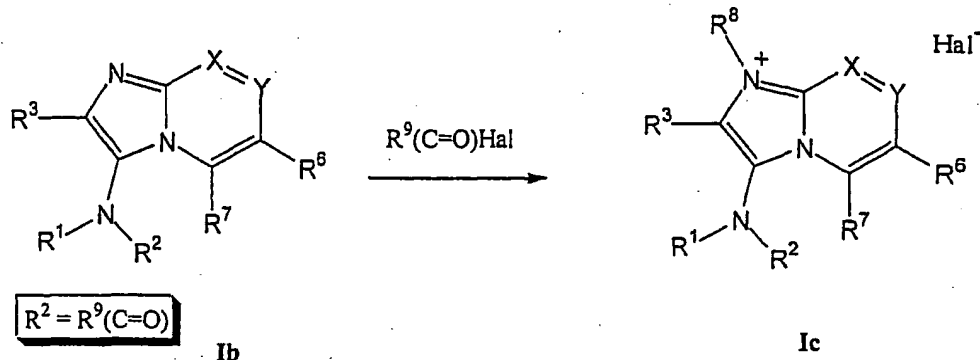


- Alternativ können die Verbindungen der allgemeinen Formel Ia mit einer starken Base, beispielsweise einer metallorganischen Verbindung wie n-Butyllithium, in einem aprotischen Lösungsmittel, wie beispielsweise DMF oder DMSO, vorzugsweise in einem Ether, wie Tetrahydrofuran oder 1,4-Dioxan, bei Temperaturen von vorzugsweise zwischen -70°C und $+20^{\circ}\text{C}$ am exocyclischen Aminostickstoff deprotoniert werden. Die anschließende Zugabe eines Säurehalogenids führt zu den Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in denen R^2 für $\text{R}^9(\text{C}=\text{O})$ steht:



10

Die nochmalige Umsetzung von Verbindungen der allgemeinen Struktur Ib mit einem Säurehalogenid führt zu den Verbindungen der allgemeinen Struktur Ic, in denen W NR^8 bedeutet, d.h. zu Verbindungen der allgemeinen Struktur Ic:



- Die erfindungsgemäß verwendeten Verbindungen der allgemeinen Struktur I können sowohl als freie Base als auch als Salz isoliert werden.
- 5 Die freie Base der erfindungsgemäß verwendeten Verbindung der allgemeinen Struktur I wird üblicherweise nach erfolgter Umsetzung gemäß dem oben beschriebenen Verfahren und anschließender herkömmlicher Aufarbeitung erhalten. Die so gewonnene oder in-situ ohne Isolierung gebildete freie Base kann dann beispielsweise durch Umsetzung mit einer
- 10 anorganischen oder organischen Säure, vorzugsweise mit Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Methansulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Kohlensäure, Ameisensäure, Essigsäure, Oxalsäure, Bernsteinsäure, Weinsäure, Mandelsäure, Fumarsäure, Milchsäure, Citronensäure, Glutaminsäure oder
- 15 Asparaginsäure, in das korrespondierende Salz überführt werden. Bei den gebildeten Salzen handelt es sich u.a. um Hydrochloride, Hydrobromide, Phosphate, Carbonate, Hydrogencarbonate, Formiate, Acetate, Oxalate, Succinate, Tartrate, Fumarate, Citrate und Glutaminäte. Die besonders bevorzugte Hydrochloridbildung kann auch durch Versetzen der in einem
- 20 geeigneten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Butan-2-on (Methylethylketon), gelösten Base mit Trimethylsilylchlorid (TMSCl) herbeigeführt werden.

- Soweit die Verbindungen der allgemeinen Struktur I als Racemate oder als
- 25 Mischungen ihrer verschiedenen Enantiomeren und/oder Diastereomeren erhalten werden, können diese Mischungen nach im Stand der Technik

wohlbekannten Verfahren aufgetrennt werden. Geeignete Methoden sind u.a. chromatographische Trennverfahren, insbesondere Flüssigkeitschromatographie-Verfahren unter Normal- oder erhöhtem Druck, bevorzugt MPLC- und HPLC-Verfahren, sowie Verfahren der fraktionierten Kristallisation. Dabei können insbesondere einzelne Enantiomeren z.B. mittels HPLC an chiraler Phase oder mittels Kristallisation von mit chiralen Säuren, etwa (+)-Weinsäure, (-)-Weinsäure oder (+)-10-Camphersulfonsäure, gebildeten diastereomeren Salzen voneinander getrennt werden.

10

Die durch erfindungsgemäße Verwendung der Verbindungen der allgemeinen Struktur I herstellbaren Arzneimittel zur NOS-Inhibierung, zur Behandlung von Migräne bzw. zur Behandlung von septischem Schock, Multipler Sklerose, Morbus Parkinson, Morbus Alzheimer, Morbus Huntington, Entzündungen, Entzündungsschmerz, cerebraler Ischämie, Diabetes, Meningitis, Arteriosklerose und/oder für die Wundheilung sind üblicherweise pharmazeutische Zusammensetzungen, die neben mindestens einer Verbindung der allgemeinen Struktur I in Form ihrer Base oder eines ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze einen oder mehrere pharmazeutische Hilfsstoffe enthalten.

20

Diese pharmazeutischen Zusammensetzungen können als flüssige, halbfeste oder feste Arzneiformen und in Form von z.B. Injektionslösungen, Tropfen, Säften, Sirupen, Sprays, Suspensionen, Granulaten, Tabletten, Pellets, Patches, Kapseln, Pflastern, Zäpfchen, Salben, Cremes, Lotionen, Gelen, Emulsionen oder Aerosolen vorliegen und verabreicht werden und enthalten neben mindestens einer Verbindung der allgemeinen Struktur I je nach galenischer Form pharmazeutische Hilfsstoffe, wie z.B. Trägermaterialien, Füllstoffe, Lösungsmittel, Verdünnungsmittel, oberflächenaktive Stoffe, Farbstoffe, Konservierungsstoffe, Sprengmittel, Gleitmittel, Schmiermittel, Aromen und/oder Bindemittel. Diese Hilfsstoffe können beispielsweise sein: Wasser, Ethanol, 2-Propanol, Glycerin,

25

30

Ethylenglycol, Propylenglycol, Polyethylenglycol, Polypropylenglycol, Glucose, Fructose, Lactose, Saccharose, Dextrose, Melasse, Stärke, modifizierte Stärke, Gelatine, Sorbitol, Inositol, Mannitol, mikrokristalline Cellulose, Methylcellulose, Carboxymethylcellulose, Celluloseacetat, 5 Schellack, Cetylalkohol, Polyvinylpyrrolidon, Paraffine, Wachse, pharmazeutisch annehmbare natürliche und synthetische Gummis, Akaziengummi, Alginate, Dextran, gesättigte und ungesättigte Fettsäuren, Stearinsäure, Magnesiumstearat, Zinkstearat, Glycerylstearat, Natriumlaurylsulfat, genießbare Öle, Sesamöl, Kokusnußöl, Erdnußöl, 10 Sojabohnenöl, Lecithin, Natriumlactat, Polyoxyethylen- und -propylenfettsäureester, Sorbitanfettsäureester, Sorbinsäure, Benzoesäure, Citronensäure, Ascorbinsäure, Tanninsäure, Natriumchlorid, Kaliumchlorid, Magnesiumchlorid, Calciumchlorid, Magnesiumoxid, Zinkoxid, Siliciumdioxid, Titanoxid, Titandioxid, Magnesiumsulfat, Zinksulfat, 15 Calciumsulfat, Pottasche, Calciumphosphat, Dicalciumphosphat, Kaliumbromid, Kaliumiodid, Talkum, Kaolin, Pectin, Crospovidon, Agar und Bentonit.

Die Auswahl der Hilfsstoffe sowie die einzusetzenden Mengen derselben 20 hängt davon ab, ob das Arzneimittel oral, subkutan, parenteral, intravenös, intraperitoneal, intradermal, intramuskulär, intranasal, buccal, rectal oder örtlich, zum Beispiel auf Infektionen an der Haut, der Schleimhäute und an den Augen, appliziert werden soll. Für die orale Applikation eignen sich u.a. Zubereitungen in Form von Tabletten, Dragees, Kapseln, Granulaten, 25 Tropfen, Säften und Sirupen, für die parenterale, topische und inhalative Applikation Lösungen, Suspensionen, leicht rekonstituierbare Trockenzubereitungen sowie Sprays. Verbindungen der allgemeinen Struktur I in einem Depot in gelöster Form oder in einem Pflaster, gegebenenfalls unter Zusatz von die Hautpenetration fördernden Mitteln, sind geeignete 30 perkutane Applikationszubereitungen. Oral oder perkutan anwendbare Zubereitungsformen können die Verbindungen der allgemeinen Struktur I verzögert freisetzen.

Die Herstellung der Arzneimittel und pharmazeutischen Zusammen-
setzungen, die eine der Verbindungen der allgemeinen Struktur I enthalten,
erfolgt mit Hilfe von im Stand der Technik der pharmazeutischen
5 Formulierung wohlbekannten Mitteln, Vorrichtungen, Methoden und
Verfahren, wie sie beispielsweise in "Remington's Pharmaceutical
Sciences", Hrsg. A.R. Gennaro, 17. Ed., Mack Publishing Company,
Easton, Pa. (1985), insbesondere in Teil 8, Kapitel 76 bis 93, beschrieben
sind.

10

So kann z.B. für eine feste Formulierung, wie eine Tablette, der Wirkstoff
des Arzneimittels, d.h. eine Verbindung der allgemeinen Struktur I oder
eines ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze, mit einem
pharmazeutischen Träger, z.B. herkömmlichen Tabletteninhaltsstoffen, wie
15 Maisstärke, Lactose, Saccharose, Sorbitol, Talkum, Magnesiumstearat,
Dicalciumphosphat oder Gummi, und pharmazeutischen
Verdünnungsmitteln, wie z.B. Wasser, gemischt werden, um eine feste
Präformulierungs-Zusammensetzung zu bilden, die eine erfindungsgemäße
Verbindung oder ein pharmazeutisch annehmbares Salz davon in
20 homogener Verteilung enthält. Unter einer homogenen Verteilung wird hier
verstanden, daß der Wirkstoff gleichmäßig über die gesamte
Präformulierungs-Zusammensetzung verteilt ist, so daß diese ohne
weiteres in gleich wirksame Einheitsdosis-Formen, wie Tabletten, Pillen
oder Kapseln, unterteilt werden kann. Die feste Präformulierungs-
25 Zusammensetzung wird anschließend in Einheitsdosis-Formen unterteilt.
Die Tabletten oder Pillen des erfindungsgemäßen Arzneimittels bzw. der
erfindungsgemäßen Zusammensetzungen können auch beschichtet oder
auf andere Weise compoundiert werden, um eine Dosisform mit
verzögerter Freisetzung bereitzustellen. Geeignete Beschichtungsmittel
30 sind u.a. polymere Säuren und Mischungen von polymeren Säuren mit
Materialien wie z.B. Schellack, Cetylalkohol und/oder Celluloseacetat.

Die an den Patienten zu verabreichende Wirkstoffmenge variiert und ist abhängig vom Gewicht, dem Alter und der Krankheitsgeschichte des Patienten, sowie von der Applikationsart, der Indikation und dem Schweregrad der Erkrankung. Üblicherweise werden 0,1 bis 5000 mg/kg, insbesondere 1 bis 500 mg/kg, vorzugsweise 2 bis 250 mg/kg Körpergewicht wenigstens einer Verbindung der allgemeinen Struktur I appliziert.

Nachfolgend werden die zur Bestimmung der NOS-Inhibition durch die Verbindungen der allgemeinen Struktur I verwendeten Assays beschrieben:

NOS-Assay

Allgemeines

Dieser Assay erlaubt die Bestimmung der prozentualen Hemmung von NO-Synthase durch einen Wirkstoff mittels Messung der NOS-Aktivität bei Einwirken des Wirkstoffs. Dabei wird NO-Synthase zusammen mit radioaktiv markiertem Arginin und dem Wirkstoff unter geeigneten Bedingungen gemischt. Nach Abbruch der NO-Bildungsreaktion zu einem vorgegebenen Zeitpunkt wird die Menge an nicht umgesetztem Arginin direkt oder indirekt bestimmt. Der Vergleich dieser Menge mit der in einem ohne Zusatz von Wirkstoff und unter sonst gleichen Bedingungen aus der Mischung von NOS und Arginin zurückbleibenden Menge an Arginin ergibt die %-Hemmung von NO-Synthase durch den getesteten Wirkstoff. Dieser Assay läßt sich wie folgt durchführen:

- (a) Inkubation der NO-Synthase mit markiertem Arginin als Substrat in einem Reaktionsgefäß,
- (b) Trennung des markierten Arginins von dem gegebenenfalls als Produkt der enzymatischen Reaktion entstandenen, markierten Citrullin zu einem Zeitpunkt, zu dem die Konzentration an Citrullin ansteigt,
- (c) Messung der Menge an jeweils abgetrenntem Arginin.

Die Trennung erfolgt über eine Filterplatten-Membran.

Dieser NOS-Assay eignet sich insbesondere für ein "High Throughput Screening" (HTS) auf Mikrotiterplatten (MTP).

5

HTS-NOS-Assay: Allgemeine Verfahrensweise

In diesem HTS-NOS-Assay wird radioaktives Arginin als Substrat benutzt. Das Assayvolumen kann je nach Art der Mikrotiterplatte (MTP) im Bereich zwischen 25 µl und 250 µl gewählt werden. In Abhängigkeit von der
10 benutzten Enzymquelle werden Cofaktoren und Coenzyme zugefügt. Die Inkubation der Ansätze in dieser Mikrotiterplatte (Assay-MTP) gemäß Schritt (a) wird bei Raumtemperatur vorgenommen und beträgt je nach verwendeter Enzymaktivität (units) zwischen 5 und 60 Minuten. Zum Ende der Inkubation (Schritt (a)) wird die Platte in einen Zellharvester platziert,
15 der mit einer MTP bestückt ist, die eine Kationenaustauschermembran als Filterboden besitzt (Filter-MTP). Alle Ansätze der Assay-MTP werden in diese Filter-MTP überführt und über eine Kationenaustauscher-Filter-Platte, einen mit Phosphatgruppen beladenen Papierfilter, abgesaugt. Die Filter-MTP wird anschließend mit Puffer oder Wasser gewaschen. Mit Hilfe
20 dieser Vorgehensweise wird das verbliebene Substrat Arginin auf dem Kationenaustauscher gebunden, während das enzymatisch gebildete radioaktive Citrullin quantitativ ausgewaschen wird. Nach Trocknen der Filter-MTP und Zugabe von Szintillationsflüssigkeit kann das gebundene Arginin am Szintillationszähler ausgezählt werden. Eine nicht gehemmte
25 NOS-Reaktion spiegelt sich in einer geringen Radioaktivität wieder. Eine gehemmte Enzymreaktion bedeutet, daß das radioaktive Arginin nicht umgesetzt worden ist. Das heißt, auf dem Filter befindet sich eine hohe Radioaktivität.

30

Verwendete Materialien

- Arginin, L-[2, 3; 4-³H]-monohydrochlorid; Best.-Nr. NET-1123, Fa. NEN

- CaCl_2 wasserfrei; Best.-Nr. 2388.1000; Fa. Merck KGaA
- 1,4-Dithiothreitol (DTT), Best.-Nr. 708984; Fa. ROCHE
- Na_2EDTA -Dihydrat; Best.-Nr. 03680; Fa. FLUKA
- HEPES, Best.-Nr. H-3375; Fa. SIGMA
- 5 - NADPH, Tetranatriumsalz; Best.-Nr. 1585363; Fa. ROCHE
- TRIS; BEST.-Nr. 93349; Fa. FLUKA

- Enzym-Präparationspuffer: 50 mM Tris-HCl mit 1 mM EDTA: Der pH-Wert des Puffers wurde bei 4 °C auf 7,4 eingestellt.
- 10 Inkubationspuffer (-medium): 50 mM HEPES mit 1 mM EDTA; 1,25 mM CaCl_2 und 1 mM Dithiothreitol. Der pH-Wert des Puffers wurde bei 25 °C auf 7,4 eingestellt.
- 15 Waschmedium: H_2O

Enzympräparation

- Als Ausgangsgewebe wurden Ratten-Cerebelli benutzt. Die Tiere wurden betäubt und getötet, das Gehirngewebe, das Cerebellum, wurde
- 20 herauspräpariert, pro Rattenkleinhirn wurde 1 ml Enzympräparationspuffer (4 °C) hinzugegeben, und es wurde mit einem Polytron-Homogenisierer für 1 min bei 6000 U/min aufgeschlossen. Danach erfolgte Zentrifugation bei 4 °C für 15 min bei 20 000 g und anschließend Abdekantieren des
- 25 Überstand und portioniertes Einfrieren bei - 80 °C (Verwerfen des Niederschlags).

Inkubationsansatz:

Verwendet wurden 96-well MTP mit einer „Well“-Kapazität von $\leq 250 \mu\text{l}$
 Pipettierreihenfolge: siehe Tabelle 1:

Tabelle 1:

Substanz	Molarität i.A.	μl	* Protein i.A:
Inkubat.-Puffer	-	100	-
Testsubstanz	variabel; vorzugsweise 10^{-5}M	variabel; vorzugsweise 20 μl	-
NADPH	0,5 mM	20	-
Enzym (s. Beispiel 3)	-	variabel; maximales Volumen der Enzymlösung = 50 μl	variabel; maximale einsetzbare Proteinmenge = 100 μg
[^3H]Substrat	variabel; vorzugsweise 50 nM	variabel; vorzugsweise 10 μl	-
Endvolumen:		max. 250 μl	

* Proteinbestimmung nach O.H. Lowry et al; J. Biol.Chem. **193**, 265 (1951)
i.A. = im Ansatz

5

Nach beendetem Pipettivorgang wurde ein Deckel auf diese MTP (Assay-MTP) gelegt. Inkubation bei 25 °C (Raumtemperatur (RT)) für 5 - 60 min, je nach Menge und Aktivität des eingesetzten Enzyms.

10

Anschließend wurde der Inhalt der Assay-MTP mit Hilfe eines 96-well Cell-Harvesters in eine 96-well Kationenaustauscher MTP (Filter-MTP) transferiert und abgesaugt. Es schloß sich eine einmalige Wäsche mit 200 ml H_2O (aus einer Wanne) an.

15

Dann wurde die Platte für 1 h bei 60 °C im Trockenschrank getrocknet. Dann wurde die Bodenseite der Filter-MTP von unten her exakt mit einem „back seal“ versiegelt. Danach wurden pro well 35 μl Szintillator

hinzupipettiert. Ferner wurde die Plattenoberseite mit einem „top seal“ versiegelt. Nach 1 h Wartezeit wurde die Platte am β -Counter ausgemessen.

- 5 Im HTS-Betrieb wurden das Inkubationsmedium, NADPH- und Enzymlösung vor Beginn des Pipettierschrittes vereint, um nicht zeitaufwendig drei separate Pipettierungen vornehmen zu müssen.

- 10 Die Ergebnisse von Beispielverbindungen im NOS-Assay sind in Tabelle 3 wiedergegeben.

Citrullin-Assay

- 15 Dieser Assay wurde wie von D. S. Bredt und S. H. Snyder (*Proc. Natl. Acad. Sci. USA* (1990), 87, 682-685) beschrieben durchgeführt. Die Ergebnisse von Beispielverbindungen im Citrullin-Assay sind in Tabelle 4 wiedergegeben.

- 20 Die folgenden Beispiele dienen der näheren Erläuterung der Erfindung, ohne sie darauf zu beschränken.

Beispiele:

- 25 Die Verbindungen der allgemeinen Struktur I wurden nach den folgenden allgemeinen Synthesevorschriften (AAV) hergestellt:

Allgemeine Arbeitsvorschrift 1 (AAV 1)

- 30 Ein Rundbodenröhrchen aus Glas (Durchmesser 16 mm, Länge 125 mm) mit Gewinde wurde mit einem Rührer versehen und mit einem Schraubdeckel mit Septum verschlossen. Das Röhrchen wurde auf einen auf 15°C temperierten Reaktorblock gestellt. Es wurden nacheinander folgende Reagenzien hinzupipettiert:

- 1.) 1 ml einer 0,1 M Amidin-II-Lösung + 10 µl 20 %ige wäßrige HClO_4 , in Dichlormethan
- 2.) 0,5 ml einer 0,3 M Lösung des Aldehyds III in Dichlormethan
- 5 3.) 0,575 ml einer 0,2 M Isonitril-IV-Lösung in Dichlormethan

Das Reaktionsgemisch wurde bei 15°C 12 h lang gerührt. Danach wurde die Reaktionslösung abfiltriert. Das Röhrchen wurde dabei zweimal mit je 1 ml Dichlormethan und 200 µl Wasser gespült.

10

Das Reaktionsgemisch wurde mit 3 ml einer 10%igen NaCl-Lösung und 1,5 ml Dichlormethan versetzt und gründlich durchmischt. Die organische Phase wurde abgetrennt und die wäßrige Phase erneut mit 1,5 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über 15 2,4 g MgSO_4 (granuliert) getrocknet. Das Lösungsmittel wurde in einer Vakuumzentrifuge entfernt.

Die eingesetzten Chemikalien und Lösungsmittel wurden kommerziell erworben. Jede Substanz wurde mit ESI-MS und/oder NMR analysiert.

20

Die gemäß AAV 1 hergestellten Beispiele 1-142 und 313-322 wurden im HTS-NOS-Assay automatisiert getestet. Die Ergebnisse sind in Tabelle 2 wiedergegeben.

25

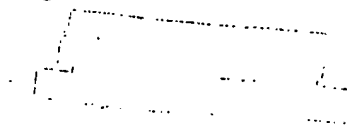


Tabelle 2

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 μ M)	Masse berechnet	Masse gefunden
1	<i>tert</i> -Butyl-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	63	280,37	281,3
2	Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	62	320,43	321,3
3	(5,7-Dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	60	350,5	351,4
4	{6-[5,7-Dimethyl-2-(1H-pyrrol-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	54	336,46	336,4
5	<i>tert</i> -Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	61	353,46	354,2
6	[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	53	395,54	396,3
7	Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	65	306,41	307,4
8	(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	52	339,48	340,4
9	(1,1,3,3-Tetramethyl-butyl)-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	59	287,45	288,4
10	Cyclohexyl-(7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	54	319,45	320,4
11	Cyclohexyl-(7-methyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	60	311,45	312,4
12	(5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	61	350,5	351,3
13	Cyclohexyl-[7-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	57	373,42	374,5
14	<i>tert</i> -Butyl-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	67	231,34	232,2
15	(7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	59	336,48	337,4
16	Cyclohexyl-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	56	355,48	356,6
17	[2-(2-Fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	51	353,48	354,3
18	(2,7-Dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-essigsäuremethylester	50	233,27	234,3
19	Methylidyne-[6-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium	53	334,44	334,4

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
20	3-(3- <i>tert</i> -Butylamino-5,7-dimethylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-2-yl)-phenol	64	309,41	310,3
21	Cyclohexyl-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl]-amin	53	323,41	324,5
22	<i>tert</i> -Butyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	68	299,46	300,3
23	Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-3-ylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	74	306,41	307,4
24	3-(3- <i>tert</i> -Butylamino-7-methylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-2-yl)-phenol	59	295,38	296,3
25	<i>tert</i> -Butyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	60	283,37	284,2
26	Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	62	309,41	310,4
27	Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-ylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	62	320,43	321,3
28	(2-Furan-2-yl-7-methylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-amin	50	325,45	326,3
29	(7-Methyl-2-pyridin-4-ylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-amin	69	336,48	337,4
30	Butyl-(2-cyclohexyl-7-methylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	56	285,43	286,4
31	3-[5,7-Dimethyl-3-(1,1,3,3-tetramethylbutylamino)-imidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-2-yl]-phenol	60	365,52	366,3
32	(2,6-Dimethyl-phenyl)-(5,7-dimethyl-2-o-tolylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	59	355,48	356,3
33	<i>tert</i> -Butyl-(7-methyl-2-naphthalen-1-ylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	67	329,44	330,4
34	(2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-fluor-phenyl)-5,7-dimethylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl]-amin	61	359,44	360,3
35	Cyclohexyl-(2,5,7-trimethylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	55	257,38	258,4
36	[5,7-Dimethyl-2-(1H-pyrrol-2-yl)-imidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-amin	69	338,49	339,5
37	Butyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-amin	58	299,46	300,3
38	(5,7-Dimethyl-2-o-tolylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-amin	60	363,54	364,3
39	[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-7-methylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	58	387,48	388,4
40	(2,7-Dimethylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-amin	61	273,42	274,3
41	[2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methylimidazo[1,2- <i>a</i>]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-amin	57	397,51	398,4

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
42	[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	55	426,38	426,3/428,2
43	(2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	71	345,42	346,3
44	(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	71	355,56	356,3
45	[6-(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium	54	337,44	337,4
46	(7-Methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	59	349,52	350,4
47	[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	69	396,32	396,3/ 398,3
48	[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	68	401,5	402,3
49	Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	67	353,46	354,3
50	Methylidyne-[6-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium	78	347,48	347,5
51	<i>tert</i> -Butyl-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	59	328,37	329,4
52	Essigsäure 5-(3-cyclohexylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-ylmethylester	64	381,47	382,4
53	[2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	61	379,54	380,3
54	[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	64	387,48	388,3
55	3-(3-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol	63	295,38	296,2
56	(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	60	375,51	376,4
57	(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	57	381,47	382,4
58	Essigsäure 5-(3-cyclohexylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-ylmethylester	64	367,44	368,4
59	[6-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium	57	348,47	348,4

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
60	Butyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	52	309,41	310,3
61	{6-[2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	73	377,51	377,3
62	{5-[5,7-Dimethyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-yl}-methanol	55	369,5	370,4
63	(7-Methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	52	385,55	386,3
64	[5-(3- <i>tert</i> -Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-yl]-methanol	52	299,37	300,3
65	<i>tert</i> -Butyl-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	62	341,41	342,4
66	(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	53	389,54	390,4
67	5-(3- <i>tert</i> -Butylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-carbonsäure	56	327,38	328,3
68	<i>tert</i> -Butyl-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	57	269,34	270,4
69	Cyclohexyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	55	243,35	244,4
70	[2-(2,3-Dichlorphenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	52	404,38	404,3/ 406,2
71	(7-Methyl-2- <i>p</i> -tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	58	349,52	350,3
72	(2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	53	357,45	358,3
73	3-(3-Butylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol	61	309,41	310,2
74	Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	62	339,43	340,4
75	{6-[5,7-Dimethyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	56	415,48	415,3
76	<i>tert</i> -Butyl-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	67	280,37	281,3
77	Cyclohexyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	63	325,49	326,4
78	[2-(2,3-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	61	410,34	410,3/ 412,2

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
79	(2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	66	371,48	372,3
80	{2-[5-(2-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	52	435,99	436,4/ 437,2/ 438,4
81	5-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure	60	369,46	370,4
82	Cyclohexyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	62	335,45	336,4
83	3-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-phenol	60	351,49	352,4
84	[2-(2,3-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	54	418,41	418,2/ 420,2
85	[2-(2,4-Dichlorphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	61	404,38	404,4/ 406,2
86	[2-(5-Bromfuran-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	54	404,35	404,3/ 406,3
87	5-(3-Cyclohexylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-carbonsäure	54	353,42	354,4
88	[6-(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium	57	353,53	353,4
89	[2-(2,4-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	68	418,41	418,3/ 420,2
90	(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	53	367,45	368,4
91	5-(3-Cyclohexylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-carbonsäure	64	339,39	340,4
92	[6-[2-(2-Bromphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl]-methylidyne-ammonium	60	426,38	425,3/ 427,2
93	<i>tert</i> -Butyl-(2-cyclohexyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	52	285,43	286,4
94	<i>tert</i> -Butyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	65	217,31	218,2
95	(5,7-Dimethyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	70	363,54	364,4
96	[2-(2,3-Dichlorphenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	55	396,32	396,3/ 398,3

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
97	Methylidyne-[6-(7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium	62	347,48	347,5
98	{2-[5-(3-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	62	435,99	436,4/ 438,3
99	Cyclohexyl-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	66	340,38	341,4
100	[2-(2-Bromphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-cyclohexyl-amin	50	384,32	384,4/ 386,4/ 387,3
101	[2-(2-Methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	58	365,52	366,4
102	{5-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-yl}-methanol	59	355,48	356,5
103	{6-[2-[5-(2-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl}-methylidyne-ammonium	50	433,96	433,4/ 435,4
104	Cyclohexyl-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	63	354,4	355,4
105	Cyclohexyl-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	65	323,43	324,4
106	[6-(5,7-Dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium	60	361,51	361,4
107	Methylidyne-[6-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium	50	334,44	334,4
108	[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	73	409,57	410,4
109	{6-[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium	51	393,51	393,4
110	5-(3-tert-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure	61	329,42	330,3
111	Cyclohexyl-(8-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	52	306,41	307,4
112	[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	52	404,38	404,3/ 406,3
113	5-(3-Butylamino-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure	54	316,38	317,3
114	Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	53	320,43	321,4

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
115	(2-Benzofuran-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	59	375,51	376,4
116	{6-[2-(2-Fluor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	60	365,47	365,3
117	[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	52	395,54	396,3
118	Methylidyne-[6-(7-methyl-2-phenanthren-9-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium	56	433,57	433,5
119	5-(3- <i>tert</i> -Butylamino-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure	56	316,38	317,4
120	<i>tert</i> -Butyl-(8-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	56	280,37	281,2
121	Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	53	295,38	296,4
122	Methylidyne-[6-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium	53	383,51	383,4
123	<i>tert</i> -Butyl-(2-cyclohexyl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	53	285,43	286,4
124	(6-Methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	68	336,48	337,4
125	<i>tert</i> -Butyl-(6-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	51	280,37	281,3
126	(7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	50	337,47	338,4
127	5-(3- <i>tert</i> -Butylamino-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure	52	329,42	330,2
128	[6-(5,7-Dimethyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium	63	397,54	397,3
129	3-[3-(2,6-Dimethyl-phenylamino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-phenol	61	357,45	358,3
130	(2,6-Dimethyl-phenyl)-(8-methyl-2- <i>o</i> -tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	58	341,45	342,3
131	{6-[2-(3-Hydroxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	55	349,45	349,4
132	{5-[3-(2,6-Dimethyl-phenylamino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-furan-2-yl}-methanol	52	348,4	349,4
133	(8-Methyl-2- <i>p</i> -tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	52	349,52	350,3

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
134	[2-(2,4-Dichlorphenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin	56	396,32	396,2/ 398,2
135	Butyl-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	50	348,27	348,3/ 350,2
136	Butyl-[2-(4-dimethylamino-naphthalen-1-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-amin	56	359,47	360,5
137	{6-[2-(2-Brom-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	52	412,35	411,3/ 414,2
138	Butyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	52	309,41	310,3
139	(2-Cyclohexyl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin	51	341,54	342,5
140	Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	55	306,41	307,3
141	Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	64	295,38	296,4
142	(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-essigsäuremethylester	59	315,41	316,4
313	[7-Ethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2-methoxy-benzyl)-amin	32	392,42	393,9
314	(2-Chlorbenzyl)-[7-ethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	47	396,83	387,3
315	[7-Ethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2-methoxy-benzyl)-amin	32	361,44	362,3
316	(2-Chlor-benzyl)-(7-ethyl-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin	52	351,84	352,4
317	(3-Chlor-4-fluor-phenyl)-[7-ethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	59	369,84	370,5
318	(2-Benzofuran-2-yl-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(3-chloro-4-fluorophenyl)-amin	52	405,86	406
319	(2-Benzofuran-2-yl-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(3-chloro-phenyl)-amin	53	387,87	388
320	(3-Chlor-4-fluorphenyl)-[2-[5-(3-chlor-phenyl)-furan-2-yl]-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	52	466,34	466/468
321	(3-Chlor-4-fluorphenyl)-[2-[5-(2-chlorphenyl)-furan-2-yl]-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	50	466,34	466/468
322	(3-Chlor-4-fluorphenyl)-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin	49	383,85	384

Als Vergleichsbeispiel wurde 7-Nitroindazol in dem NOS-Assay getestet mit einer Hemmung (10 μ M) von 50%.

Allgemeine Arbeitsvorschrift 2 (AAV 2):

- 5 In einem mit einem Rührer versehenen Rundbodenröhrchen wurden ca. 0,05 mmol des jeweiligen nach AAV 1 erhaltenen Edukts der allgemeinen Struktur I in fester Form vorgelegt. Unter Rühren wurden bei 18 °C 2 ml Dichlormethan zugegeben. Die Lösung wurde mit 4 Äquivalenten Acetylchlorid (0,2 M Lösung in Dichlormethan) versetzt, und es wurde 4 h
10 gerührt.

Anschließend wurde der Rührer entfernt, und die organischen Lösungen wurden in einer Vakuumzentrifuge bei 40-50 °C bis zur Trockene eingeeengt. Zur Charakterisierung wurde ein ESI-MS aufgenommen.

15

Die gemäß AAV 2 hergestellten Beispiele 143-291 wurden im HTS-NOS-Assay (HTS) automatisiert getestet; die Ergebnisse sind in Tabelle 3 wiedergegeben.

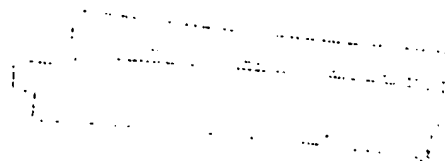


Tabelle 3

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
143	N-(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	68	381,51	(M-Acetyl) 340,5
144	N-tert-Butyl-N-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	59	322,41	(M-Acetyl) 281,4
145	N-tert-Butyl-N-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	66	325,41	(M-Acetyl) 284,3
146	N-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	59	392,54	(M-Acetyl) 351,4
147	N-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	68	392,54	(M-Acetyl) 351,5
148	N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(5,7-dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	57	397,52	(M-Acetyl) 356,4
149	N-(2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	55	367,49	(M-Acetyl) 326,5
150	N-(1,1,3,3-Tetramethyl-butyl)-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	60	329,48	(M-Acetyl) 288,5
151	N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	65	353,48	(M-Acetyl) 312,5
152	N-tert-Butyl-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	66	273,37	(M-Acetyl) 232,3
153	5-[3-(Acetyl-tert-butyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure	78	358,41	(M-Acetyl) 317,5
154	5-[3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure	60	425,52	(M-Acetyl) 384,6
155	N-[2-(5-Hydroxymethyl-furan-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	50	411,54	370,4; (M-Acetyl) 412,4
156	N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	74	468,42	(M-Acetyl) 426,3/428,3
157	N-tert-Butyl-N-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	63	341,49	(M-Acetyl) 300,4
158	Essigsäure 5-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethyl ester	54	423,51	(M-Acetyl) 382,4
159	{6-[Acetyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methyldiyne-ammonium	61	379,48	(M-Acetyl) 337,4

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
160	N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	55	438,35	(M-Acetyl) 396,4/ 398,3
161	N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid	51	418,36	(M-Acetyl) 376,5/ 378,4
162	N-(5,7-Dimethyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	67	405,58	(M-Acetyl) 364,4
163	N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	63	348,44	(M-Acetyl) 307,4
164	N-Cyclohexyl-N-[7-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	61	415,45	(M-Acetyl) 374,5
165	N-(6,8-Dibrom-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	67	511,26	(M-Acetyl) 468,3/ 470,2/ 472,2
166	N-(7-Methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	61	378,51	(M-Acetyl) 337,4
167	Acetic acid 5-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethyl ester	68	409,48	(M-Acetyl) 368,5
168	N-(7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	56	378,51	(M-Acetyl) 337,4
169	N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	57	452,38	(M-Acetyl) 410,3/ 412,2/ 413,2
170	N-Cyclohexyl-N-[5,7-dimethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	65	365,47	(M-Acetyl) 324,4
171	N-Butyl-N-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	63	395,5	(M-Acetyl) 354,4
172	N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	62	421,58	(M-Acetyl) 380,4
173	N-Cyclohexyl-N-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	67	396,44	(M-Acetyl) 355,4
174	[Acetyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-acetic acid methyl ester	68	275,3	(M-Acetyl) 234,4
175	N-Cyclohexyl-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	52	299,41	(M-Acetyl) 258,4
176	5-[3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure	50	413,53	(M-Acetyl) 372,5

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
177	N-[2-(2,4-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	67	460,44	(M-Acetyl) 418,3/ 420,3/ 421,2
178	N-Cyclohexyl-N-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	64	382,41	(M-Acetyl) 341,5
179	N-(2-tert-Butyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	60	363,5	(M-Acetyl) 322,4
180	N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	54	413,52	(M-Acetyl) 372,4
181	N-[2-(3-Hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	60	407,55	408,3; (M-Acetyl) 366,4
182	N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-fluor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	53	401,48	(M-Acetyl) 360,4
183	5-[3-(Acetyl-tert-butyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure	50	371,45	(M-Acetyl) 330,4
184	N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	51	399,49	(M-Acetyl) 358,5
185	N-(7-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	55	391,55	(M-Acetyl) 350,4
186	5-[3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure	65	411,5	(M-Acetyl) 370,5
187	N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	67	348,44	(M-Acetyl) 307,4
188	N-[2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	50	453,58	(M-Acetyl) 412,3
189	N-(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	63	423,51	(M-Acetyl) 382,5
190	N-tert-Butyl-N-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	69	311,38	(M-Acetyl) 270,3
191	N-tert-Butyl-N-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	57	322,41	(M-Acetyl) 281,3
192	N-Cyclohexyl-N-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	72	362,47	(M-Acetyl) 321,4
193	N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	55	460,44	(M-Acetyl) 418,3/ 420,3/ 421,1

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
194	N-[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	59	451,61	(M-Acetyl) 410,4
195	N-[2-[3-(4-chlor-phenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	54	481,98	(M-Acetyl) 440,4/ 441,4/ 442,4
196	N-[2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	54	439,55	(M-Acetyl) 398,4
197	5-[3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure	70	395,45	(M-Acetyl) 354,4
198	N-tert-Butyl-N-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	54	356,38	(M-Acetyl) 314,4
199	N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	57	407,55	(M-Acetyl) 366,4
200	N-[2-(5-Methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	58	367,49	(M-Acetyl) 326,4/ 327,4
201	5-[3-(Acetyl-tert-butyl-amino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure	54	355,39	(M-Acetyl) 314,4
202	N-[2-(4,5-Dimethyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	57	381,51	(M-Acetyl) 340,6
203	N-Cyclohexyl-N-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	60	351,44	(M-Acetyl) 310,4
204	N-tert-Butyl-N-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	54	371,48	(M-Acetyl) 330,4
205	5-[3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure	52	414,52	(M-Acetyl) 373,4
206	N-Butyl-N-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-acetamid	54	322,41	339,4/ 340,4
207	N-[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	51	429,51	(M-Acetyl) 388,4
208	N-tert-Butyl-N-(7-methyl-2-phenanthren-9-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	63	421,54	(M-Acetyl) 380,5
209	N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	62	387,45	(M-Acetyl) 346,4/ 347,3
210	N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	53	407,55	(M-Acetyl) 366,4

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
211	N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	73	399,49	(M-Acetyl) 358,4
212	N-(2-tert-Butyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	68	349,47	(M-Acetyl) 308,4
213	Acetic acid 4-{3-[acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-6-brom-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-2-methoxy-phenyl ester	69	536,43	(M-Acetyl) 494,3/ 497,3
214	N-tert-Butyl-N-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	56	383,44	(M-Acetyl) 336,2
215	[6-(Acetyl-{7-methyl-2-[5-(2-nitro-phenyl)-furan-2-yl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amino)-hexyl]-methylidyne-ammonium	50	486,55	487,5; (M-Acetyl) 444,5
216	N-(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	50	417,55	(M-Acetyl) 376,4/ 377,3
217	N-(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	63	431,57	(M-Acetyl) 390,4/ 391,4
218	5-[3-(Acetyl-tert-butyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure	60	357,43	(M-Acetyl) 316,5
219	N-(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	62	397,6	(M-Acetyl) 356,5
220	N-tert-Butyl-N-[2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	61	311,38	(M-Acetyl) 270,4
221	N-tert-Butyl-N-[2-(5-methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid	54	360,5	(M-Acetyl) 319,4
222	N-[2-(4,5-Dimethyl-furan-2-yl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	53	395,54	(M-Acetyl) 354,5
223	N-Butyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid	62	377,27	377,4/ 379,4
224	N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid	53	432,38	(M-Acetyl) 390,4/ 392,4
225	5-[3-[Acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure	55	419,5	(M-Acetyl) 378,4
226	N-Butyl-N-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	62	381,47	382,5
227	N-tert-Butyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	54	376,28	(M-Acetyl) 334,3/ 336,3

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
228	N-(2-Furan-2-yl-5-propyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	53	395,54	(M-Acetyl) 354,4
229	5-[3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure	59	383,46	(M-Acetyl) 342,5
230	5-[3-(Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure	52	411,5	(M-Acetyl) 370,6
231	3-(Acetyl-butyl-amino)-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-8-carbonsäure	52	352,39	353,5
232	{6-[Acetyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	59	390,51	(M-Acetyl) 348,5
233	N-tert-Butyl-N-[2-(5-methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-acetamid	53	360,5	(M-Acetyl) 319,2
234	5-[3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure	58	397,49	(M-Acetyl) 356,4
235	N-[2-(5-Methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	58	416,6	(M-Acetyl) 375,3
236	N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	58	438,35	(M-Acetyl) 396,3/ 398,3
237	N-Butyl-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	55	337,42	338,5
238	{6-[Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-6-nitro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	52	436,49	436,5
239	N-(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	52	409,48	(M-Acetyl) 368,5
240	{6-[Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	61	419,54	(M-Acetyl) 377,5
241	{6-[Acetyl-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	62	376,48	(M-Acetyl) 334,5
242	N-(6-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	58	391,55	(M-Acetyl) 350,4
243	Acetic acid 5-[3-[acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethyl ester	62	445,51	(M-Acetyl) 404,4
244	{Acetyl-[2-(3-hydroxy-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino}-acetic acid methyl ester	50	353,37	354,4; (M-Acetyl) 312,4

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
245	N- <i>tert</i> -Butyl-N-[2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	56	375,39	(M-Acetyl) 334,3
246	N-Butyl-N-[2-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	55	359,83	360,4
247	N-[2-(2,4-Dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid	56	424,33	(M-Acetyl) 382,4/ 384,3
248	5-[3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-furan-2-carbonsäure	52	412,48	(M-Acetyl) 371,8
249	Acetic acid 5-[3-[acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-furan-2-ylmethyl ester	54	426,51	(M-Acetyl) 385,4
250	N-(2,7-Dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	58	315,46	(M-Acetyl) 274,5
251	Acetic acid 4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5-amino-7-chlor-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenyl ester	51	471,94	472,4; (M-Acetyl) 430,4/ 432,4
252	Acetic acid 4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenyl ester	53	450,53	(M-Acetyl) 409,5
253	N-[6-Brom-2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid	51	478,79	(M-Acetyl) 436,4/ 438,3/ 440,3
254	N-[2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid	51	399,89	(M-Acetyl) 358,3
255	N-Butyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid	65	377,27	377,4/ 379,4
256	N-[2-(5-chlor-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	55	404,96	(M-Acetyl) 363,3/ 365,3/ 367,3
257	[Acetyl-(2-cyclohexyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-acetic acid methyl ester	56	343,42	(M-Acetyl) 302,5
258	N- <i>tert</i> -Butyl-N-[2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	60	359,83	(M-Acetyl) 318,3/ 320,3
259	N-Cyclohexyl-N-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	73	362,47	(M-Acetyl) 321,4
260	Acetic acid 5-[3-[acetyl-cyclohexyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethyl ester	51	409,48	(M-Acetyl) 368,6
261	N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[6-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	61	437,46	(M-Acetyl) 396,4

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
262	N-Cyclohexyl-N-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	54	337,42	(M-Acetyl) 296,5
263	N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	64	348,44	349,4; (M-Acetyl) 307,4
264	N-Cyclohexyl-N-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	50	409,48	(M-Acetyl) 368,4
265	N-tert-Butyl-N-(5-propyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	54	350,46	(M-Acetyl) 309,3
266	N-tert-Butyl-N-[2-(5-methyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid	53	328,43	(M-Acetyl) 287,3
267	3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-8-carbonsäure	62	397,47	(M-Acetyl) 356,7
268	N-tert-Butyl-N-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	51	339,43	(M-Acetyl) 298,4
269	N-[2-[3-(4-chlor-phenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid	51	459,97	460,4/ 462,4; (M-Acetyl) 418,5/ 419,4
270	Acetic acid 4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenyl ester	52	422,48	423,4; (M-Acetyl) 381,4
271	N-[2-(5-Brom-furan-2-yl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	51	446,39	(M-Acetyl) 404,4/ 406,3
272	N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid	54	400,48	359,5 (M-Acetyl) 401,4
273	N-Cyclohexyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	55	402,32	(M-Acetyl) 360,4/ 362,4
274	N-Cyclohexyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	64	416,35	(M-Acetyl) 374,4/ 376,3
275	N-Cyclohexyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid	59	403,31	(M-Acetyl) 361,4/ 363,3
276	[Acetyl-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl)-amino]-acetic acid methyl ester	50	338,36	(M-Acetyl) 297,4
277	N-tert-Butyl-N-(6,8-dichlor-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	53	382,31	(M-Acetyl) 340,3/ 342,2
278	N-tert-Butyl-N-(5-propyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	55	355,5	(M-Acetyl) 340,3/ 342,2

Beispiel-Nr.	Verbindung	HTS-NOS-Assay: %-Hemmung (10 µM)	Masse berechnet	Masse gefunden
279	{6-[Acetyl-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	71	389,52	389,6 (M-Acetyl) 347,6
280	N-Butyl-N-(6-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	53	335,45	336,5; (M-Acetyl) 294,5
281	(6-[Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino]-hexyl)-methylidyne-ammonium	62	405,52	405,5
282	5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-furan-2-carbonsäure	51	411,5	(M-Acetyl) 370,4
283	N-Butyl-N-[2-(3,4,5-trimethoxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-acetamid	51	398,46	399,5, (M-Acetyl) 357,5
284	N-Butyl-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid	51	324,38	325,4; (M-Acetyl) 283,3
285	[Acetyl-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-amino]-acetic acid methyl ester	51	338,36	339,3; (M-Acetyl) 297,4
286	N-(2-Benzofuran-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid	59	417,55	(M-Acetyl) 376,4/ 377,4
287	N-Butyl-N-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-acetamid	58	336,43	337,5
288	N-tert-Butyl-N-(6,8-dibrom-2-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid	62	403,12	(M-Acetyl) 362,2
289	{6-[Acetyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium	63	390,51	(M-Acetyl) 348,5
290	N-tert-Butyl-N-[2-(2-ethoxy-naphthalen-1-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	67	415,53	(M-Acetyl) 374,4
291	N-tert-Butyl-N-[2-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid	53	359,83	(M-Acetyl) 318,3/ 319,2

Allgemeine Arbeitsvorschrift 3 (AAV 3)

(Äquivalente bedeuten Stoffmengenäquivalente zum eingesetzten Isonitril):

5 Im Reaktionsgefäß wurde zunächst 1,15 Äquivalente des heterocyclischen Amins der allgemeinen Struktur II in Dichlormethan (2 ml je mmol eingesetztem Isonitril IV) suspendiert bzw. gelöst. Hierzu wurden nacheinander 1,5 Äquivalente Aldehyd III, ein Äquivalent Isonitril IV und schließlich wäßrige Perchlorsäurelösung (20 m%; 0,098 ml je mmol eingesetztem Isonitril) zugegeben und der Ansatz für zwanzig Stunden bei 10 Raumtemperatur gerührt.

Zur Aufarbeitung wurden gesättigte Natriumchloridlösung (ca. 5 ml je mmol eingesetztem Isonitril) und Dichlormethan (ca. 4 ml je mmol eingesetztem Isonitril) zugegeben, die Phasen getrennt und die organische Phase noch 15 zweimal mit Dichlormethan (je ca. 2 ml je mmol eingesetztem Isonitril) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden nacheinander mit Pufferlösung (pH 10; Merck Art.-Nr. 1.09438.1000; ca. 2 ml je mmol eingesetztem Isonitril) und ges. Natriumchloridlösung (ca. 2 ml je mmol eingesetztem Isonitril) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, 20 am Rotationsverdampfer im Vakuum eingeeengt und im Ölpumpenvakuum von Lösungsmittelresten befreit.

Das erhaltene Rohprodukt wurde entweder direkt einer Hydrochloridfällung zugeführt (Lösen der Rohbase in ca. 10 ml 2-Butanon je Gramm Base; 25 Zugabe eines halben Moläquivalents Wasser, gefolgt von 1,1 Moläquivalenten Chlortrimethylsilan und Rühren über Nacht.), oder mit Hexan (ca. 10 ml je mmol eingesetztem Isonitril) unter Rühren zum Rückfluß erhitzt. Löste sich das Rohprodukt nicht vollständig wurde heiß abdekantiert. Nach Erkalten der Hexanlösung wurde ein gegebenenfalls 30 erhaltener Feststoff abfiltriert und im Ölpumpenvakuum getrocknet. Etwaige Nachfällungen wurden getrennt analog behandelt. Das erhaltene Filtrat wurde am Rotationsverdampfer eingeeengt und der Rückstand

wiederum im Ölpumpenvakuum getrocknet. Auf diesem Wege wurden bis zu vier Fraktionen erhalten:

- 0: Keine Behandlung mit Hexan
 - 5 1: In Hexan unlöslicher Rückstand
 - 2: Aus Hexanlösung beim Erkalten ausgefallener Feststoff
 - 3: Nachfällung
 - 4: Rückstand aus zur Trockne eingedampfter Hexanlösung
- 10 Aus den jeweils erhaltenen Fraktionen wurde durch dünnschichtchromatographische und/oder NMR-spektroskopische Untersuchungen die Produktfraktion(en) identifiziert (in der Regel der aus der Hexanlösung ausgefallene Feststoff).
- 15 Von einem Teil einer Produktfraktion wurde schließlich ein Hydrochlorid gefällt (s.o.).

- Die gemäß AAV 3 hergestellten Beispiele 292-298 wurden im Citrullin-Assay getestet; die Ergebnisse sind in Tabelle 4 wiedergegeben. Ferner
- 20 wurden beispielhaft gemäß AAV 3 hergestellt: Cyclohexyl-(7-methyl-2-phenyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid, (2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid und *tert*-Butyl-[2-(4-nitro-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-amin-Hydrochlorid.

Tabelle 4

Beispiel-Nr.	Name	Ansatz	Ausbeute	Produkt-fraktion	Citrullin-Assay
		mmol Isonitril	g Produkt-fraktion		IC ₅₀ (μ M)
292	Cyclohexyl-[7-methyl-2-(2-trifluoromethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin; Hydrochlorid	21,3	5,93	0	2,4
293	<i>tert</i> -Butyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin; Hydrochlorid	18,8	4,64	0	2,8
294	<i>tert</i> -Butyl-(7-methyl-2-phenyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin; Hydrochlorid	54,1	9,06	2	2,4
295	Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin; Hydrochlorid	50,4	12,2	2	9,2
296	(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin; Hydrochlorid	47,9	13,9	4	2,5
297	<i>tert</i> -Butyl-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin; Hydrochlorid	48,1	10,5	2 + 4	9,2
298	[2-(2-Fluorphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin; Hydrochlorid	43,1	15,9	4	4,3
299	Cyclohexyl-(7-methyl-2-phenyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin; Hydrochlorid	5,00	1,64	2	
300	(2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin; Hydrochlorid	43,1	10,2	2 + 3	
301	<i>tert</i> -Butyl-[2-(4-nitro-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-amin; Hydrochlorid	48,1	15,1	2	

Als Vergleichsbeispiel wurde im Citrullin-Assay der aus dem Stand der Technik bekannte NOS-Inhibitor 7-Nitroindazol mit einem IC₅₀-Wert von 5,23 μ M getestet.

Ferner wurden die Beispielsverbindungen 302 bis 312 gemäß AAV 3 hergestellt und im oben beschriebenen NOS-Assay auf %-Hemmung getestet. Die Ergebnisse sind in Tabelle 5 wiedergegeben.

5

Tabelle 5

Beispiel Nr.	Name	NOS-Assay	Ansatz	Ausbeute	Produkt-fraktion
		% Hemmung	mmol Isonitril	g Produkt-fraktion	
302	Cyclohexyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid	54	9.2	1.9	2
303	Cyclopentyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid	57	10.5	2.1	2
304	[2-(4-Brom-2-fluorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-cyclopentyl-amin-Hydrochlorid	56	6.3	1.9	4
305	Cyclopentyl-{5,7-dimethyl-2-[5-(2-nitro-phenyl)-furan-2-yl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amin-Hydrochlorid	55	6.3	3	2
306	{2-[5-(4-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-cyclopentyl-amin-Hydrochlorid	73	6.7	1.7	2
307	Cyclopentyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid	57	10.5	2.6	4
308	(2-Furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid	50	25.1	5.6	2
309	Benzyl-(7-methyl-2-thiophen-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid	45	21.8	4.1	2
310	Cyclohexyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid	52	22.9	5.2	2
311	(2-Furan-3-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid	45	25.1	2.9	2
312	(5,7-Dimethyl-2-thiophen-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid	74	18	4.6	4

Allgemeine Arbeitsvorschrift 4 (AAV 4):

- Das gemäß AAV 3 erhaltene Edukt (Produktfraktion) wurde im Reaktionsgefäß in Tetrahydrofuran (ca. 3 ml je mmol Edukt) vorgelegt, unter Rühren bei -15 bis -5 °C 1,10 Stoffmengenäquivalente n-Butyllithiumlösung in Hexan (1,6 mol/l) zugetropft und eine Stunde nachgerührt. Anschließend wurden 1,05 Stoffmengenäquivalente des Acetylchlorids zugetropft und über Nacht unter Erwärmung auf Raumtemperatur gerührt.
- Zur Aufarbeitung wurde auf 0 bis 5 °C gekühlt und halbgesättigte Ammoniumchloridlösung (ca. 1,5 ml je mmol Edukt) zugegeben. Es wurde dreimal mit Ether (ca. 1,5 ml je mmol Edukt) extrahiert, die vereinigten Extrakte über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt.
- Ein Teil des so erhaltenen Produkts wurde nach dünnschichtchromatographischer und/oder NMR-spektroskopischer Untersuchungen einer Hydrochloridfällung gem. AAV 3 zugeführt.
- Bei den gemäß AAV 4 beispielhaft hergestellten Verbindungen handelt es sich um N-{2-[3-(4-Chlorphenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-N-cyclohexyl-acetamid-Hydrochlorid, N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid-Hydrochlorid und N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2,4-dimethyl-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid-Hydrochlorid.

Allgemeine Arbeitsvorschrift 5 (AAV 5):

- Das gemäß AAV 4 erhaltene Edukt wurde im Reaktionsgefäß vorgelegt, es wurden unter Rühren zehn Stoffmengenäquivalente des jeweiligen Säurehalogenids zugegeben und eine Stunde bei 40 °C gerührt.

Das Reaktionsgemisch wurde in wenig Dichlormethan aufgenommen, das Produkt durch Zugabe von Ether und ggf. Hexan ausgefällt und anschließend umkristallisiert.

- 5 Mit dieser Vorgehensweise wurde aufgrund des Wassergehalts der verwendeten Lösungsmittel in der Regel das gewünschte Produkt als Hydrohalogenid erhalten oder alternativ einer Hydrochloridfällung gem. AAV 3 zugeführt.
- 10 Beispielhaft wurde gemäß AAV 5 1-Acetyl-3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-1-ium Chlorid-Hydrochlorid hergestellt.

Pharmazeutische Formulierung für die erfindungsgemäße Verwendung

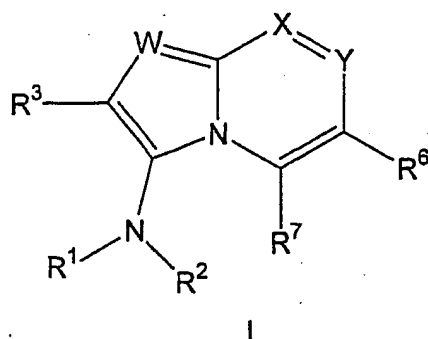
1 g des Hydrochlorids von (5,7-Dimethyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin wurde in 1 l Wasser für
5 Injektionszwecke bei Raumtemperatur gelöst und anschließend durch Zugabe von Natriumchlorid auf isotone Bedingungen eingestellt.

In gleicher Weise wurde eine isotonische Lösung von 1 g (5,7-Dimethyl-2-thiophen-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-
10 Hydrochlorid in 1 l Wasser hergestellt.

Ansprüche

1. Verwendung einer Verbindung der allgemeinen Struktur I oder eines ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze

5



worin

10

X CR⁴ oder N bedeutet,
Y CR⁵ oder N bedeutet und
X und Y nicht zugleich N bedeuten,

15

W N oder NR⁸ bedeutet,

20

R¹ C₁₋₁₂-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-Aryl oder C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt

25

ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,

5

R^2 Wasserstoff oder $C(=O)R^9$ bedeutet,

10

R^3 C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{1-8} -Alkyl- C_{3-8} -Cycloalkyl, C_{1-8} -Alkyl-Heterocyclyl, C_{1-8} -Alkyl-Aryl oder C_{1-8} -Alkyl-Heteroaryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,

15

20

25

30

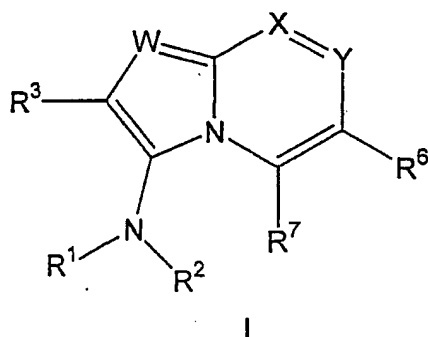
R^4 , R^5 , R^6 und R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2 - C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und

- unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, NH₂, C(=O)R⁹, CO₂H, CO₂R¹⁰, OH oder OR¹¹ bedeuten,
oder
- 5 R⁴ und R⁵ oder R⁵ und R⁶ oder R⁶ und R⁷ für eine viergliedrige gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffbrücke mit keinem, 1, 2 oder 3 Heteroatomen, die aus der Gruppe, die N, O und S enthält, ausgewählt sind, stehen und die anderen Reste von R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ Wasserstoff bedeuten,
- 10 R⁸ C(=O)R⁹ bedeutet,
- 15 R⁹ C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist,
- 20 Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-Aryl oder C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl bedeutet, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und
- 25 unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet, und
- 30 R¹⁰ und R¹¹ unabhängig voneinander C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist,

C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-Aryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeuten,

zur Herstellung eines Medikaments zur NO-Synthase-Inhibierung.

2. Verwendung einer Verbindung der allgemeinen Struktur I oder eines ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze



worin

X CR⁴ oder N bedeutet,
 Y CR⁵ oder N bedeutet und
 X und Y nicht zugleich N bedeuten,

W N oder NR⁸ bedeutet,

R¹ C₁₋₁₂-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder

mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-Aryl oder C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,

15 R² Wasserstoff oder C(=O)R⁹ bedeutet,

20 R³ C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-C₃₋₈-Cycloalkyl, C₁₋₈-Alkyl-Heterocyclyl, C₁₋₈-Alkyl-Aryl oder C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder

mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,

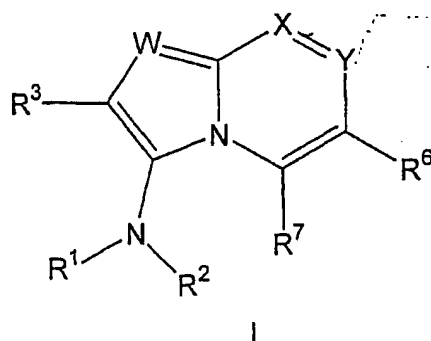
- 5 R^4 , R^5 , R^6 und R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2 - C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und
- 10 unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , NH_2 , $C(=O)R^9$, CO_2H , CO_2R^{10} , OH oder OR^{11} bedeuten,
- oder
- 15 R^4 und R^5 oder R^5 und R^6 oder R^6 und R^7 für eine viergliedrige gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffbrücke mit keinem, 1, 2 oder 3 Heteroatomen, die aus der Gruppe, die N, O und S enthält, ausgewählt sind, stehen und die anderen Reste von R^4 , R^5 , R^6 und R^7 Wasserstoff bedeuten,
- 20 R^8 $C(=O)R^9$ bedeutet,
- R^9 C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2 - C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und
- 25 unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach
- 30 substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{1-8} -Alkyl-Aryl oder C_{1-8} -Alkyl-Heteroaryl bedeutet, wobei Alkyl geradkettig oder

verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und
unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl
unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und
Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert
ist, bedeutet, und

R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2 - C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{1-8} -Alkyl-Aryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeuten,

zur Herstellung eines Medikaments zur Behandlung von Migräne.

3. Verwendung einer Verbindung der allgemeinen Struktur I oder eines ihrer pharmazeutisch annehmbaren Salze



worin

X CR⁴ oder N bedeutet,
Y CR⁵ oder N bedeutet und
X und Y nicht zugleich N bedeuten,

5

W N oder NR⁸ bedeutet,

10

R¹ C₁₋₁₂-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-Aryl oder C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,

15

20

R² Wasserstoff oder C(=O)R⁹ bedeutet,

25

R³ C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder

30

ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei
Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert
ist, C₁₋₈-Alkyl-C₃₋₈-Cycloalkyl, C₁₋₈-Alkyl-Heterocyclyl, C₁₋₈-
Alkyl-Aryl oder C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl, wobei Alkyl geradkettig
5 oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und
unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist,
Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert
oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl gesättigt
oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder
10 mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder
mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder
ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,

R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ unabhängig voneinander Wasserstoff oder C₁₋₈-
15 Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt
oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder
mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-
Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und
unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, F, Cl,
20 Br, I, CN, NO₂, NH₂, C(=O)R⁹, CO₂H, CO₂R¹⁰, OH oder OR¹¹
bedeuten,

oder
R⁴ und R⁵ oder R⁵ und R⁶ oder R⁶ und R⁷ für eine viergliedrige
gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffbrücke mit
25 keinem, 1, 2 oder 3 Heteroatomen, die aus der Gruppe, die N,
O und S enthält, ausgewählt sind, stehen und die anderen
Reste von R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ Wasserstoff bedeuten,

R⁸ C(=O)R⁹ bedeutet,

30

R⁹ C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und
gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder

mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heterocyclyl, wobei Heterocyclyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Heteroaryl, wobei Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-Aryl oder C₁₋₈-Alkyl-Heteroaryl bedeutet, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Heteroaryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet, und

15

R¹⁰ und R¹¹ unabhängig voneinander C₁₋₈-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₃₋₈-Cycloalkyl oder CH₂-C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C₁₋₈-Alkyl-Aryl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und gesättigt oder ungesättigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist und Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeuten,

20

25

30

zur Herstellung eines Medikaments zur Behandlung von septischem Schock, Multipler Sklerose, Morbus Parkinson, Morbus Alzheimer, Morbus Huntington, Entzündungen, Entzündungsschmerz, cerebraler Ischämie, Diabetes, Meningitis, Arteriosklerose und/oder für die Wundheilung.

4. Verwendung nach einem der Ansprüche 1, 2 oder 3, dadurch gekennzeichnet, daß

5 R¹ Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, n-Hexyl,
 n-Octyl, 1,1,3,3-Tetramethylbutyl, CH₂Aryl, wobei Aryl
 unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist,
 CH₂CO₂-C₁₋₆-Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist,
 CH₂PO(O-C₁₋₆-Alkyl)₂, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt
10 ist, CH₂SiR¹²R¹³R¹⁴, CH₂CH₂-Morpholin-4-yl, (CH₂)_n-NC mit n
 = 2, 3, 4, 5 oder 6, C₃₋₈-Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl
 unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, oder
 Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach
 substituiert ist, bedeutet,

15 R² H oder C(=O)-C₁₋₄-Alkyl bedeutet,

 R³ Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl,
 Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, die unsubstituiert
 oder ein- oder mehrfach substituiert sind, Phenyl, wobei
 Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist,
20 1-Naphthyl oder 2-Naphthyl, wobei Naphthyl unsubstituiert
 oder ein- oder mehrfach substituiert ist, 9-Phenanthrenyl,
 Pyrrol-2-yl, Pyrrol-3-yl, Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl oder Pyridin-4-
 yl, wobei Pyrrolyl oder Pyridinyl unsubstituiert oder ein- oder
 mehrfach substituiert sind, Furan-2-yl oder Furan-3-yl, wobei
 Furanyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist,
25 Thien-2-yl oder Thien-3-yl, wobei Thienyl unsubstituiert oder
 ein- oder mehrfach substituiert ist, Imidazol-2-yl, Imidazol-4-yl,
 Imidazol-5-yl, wobei Imidazolyl unsubstituiert oder ein- oder
 mehrfach substituiert ist, Thiazol-2-yl, Thiazol-4-yl, Thiazol-5-
 yl, wobei Thiazolyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach
30 substituiert ist, Oxazol-2-yl, Oxazol-4-yl, Oxazol-5-yl, wobei
 Oxazolyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert
 ist, Isooxazol-3-yl, Isooxazol-4-yl, Isooxazol-5-yl, wobei

Isooxazolyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, Indol-2-yl, Benzofuran-2-yl oder Benzofuran-3-yl bedeuten,

R^4 , R^5 , R^6 und R^7 unabhängig voneinander H, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, CF_3 , F, Cl, Br, I, CO_2H , CO_2 Methyl, CO_2 Ethyl, $C(=O)CH_3$ oder NO_2 bedeuten oder R^6 und R^7 die Kohlenwasserstoffbrücke $-CH=CH-CH=CH-$ bilden,

R^8 $C(=O)CH_3$ bedeutet, und

R^{12} , R^{13} und R^{14} unabhängig voneinander C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2-C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, oder Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeuten.

5. Verwendung nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, daß

R^1 Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, n-Hexyl, n-Octyl, 1,1,3,3-Tetramethylbutyl, CH_2 Aryl, wobei Aryl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, $CH_2CO_2-C_{1-6}$ -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist, $CH_2PO(O-C_{1-6}-Alkyl)_2$, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist, $CH_2SiR^{12}R^{13}R^{14}$, CH_2CH_2 -Morpholin-4-yl, $(CH_2)_n-NC$ mit $n = 2, 3, 4, 5$ oder 6 , C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, oder Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeutet,

R^2 H oder $C(=O)-C_{1-4}$ -Alkyl bedeutet,

R^3 Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, die unabhängig voneinander unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert

sind, Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino substituiert ist, 1-Naphthyl oder 2-Naphthyl, wobei Naphthyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino substituiert ist, 9-Phenanthrenyl, Pyrrol-2-yl, Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl oder Pyridin-4-yl, wobei Pyridinyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino, Carboxy, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Hydroxymethyl, Chlorphenyl, Nitrophenyl, [1,3]-Dioxolan, Methylsulfanyl substituiert ist, Furan-2-yl oder Furan-3-yl, wobei Furanyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino, Carboxy, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Hydroxymethyl, Chlorphenyl, Nitrophenyl, [1,3]-Dioxolan, Methylsulfanyl substituiert ist, Thien-2-yl oder Thien-3-yl, wobei Thienyl unsubstituiert oder einfach oder gleich oder verschieden mehrfach mit Methyl, Ethyl, n-Propyl, Prop-2-yl, n-Butyl, sec.-Butyl, tert-Butyl, iso-Butyl, CF₃, OH, OMethyl, OEthyl, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, 4-Chlorphenoxy, Acetoxy, Dimethylamino, Carboxy, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Hydroxymethyl, Chlorphenyl, Nitrophenyl, [1,3]-Dioxolan,

Methylsulfanyl substituiert ist, Indol-2-yl, Benzofuran-2-yl oder Benzofuran-3-yl bedeuten,

R^4 , R^5 , R^6 und R^7 unabhängig voneinander H, Methyl, Ethyl, n-Propyl, 2-Propyl, n-Butyl, tert-Butyl, CF_3 , F, Cl, Br, I, CO_2H , $CO_2Methyl$, CO_2Ethyl , $C(=O)CH_3$ oder NO_2 bedeuten oder R^6 und R^7 die Kohlenwasserstoffbrücke $-CH=CH-CH=CH-$ bilden,

R^8 $C(=O)CH_3$ bedeutet, und

R^{12} , R^{13} und R^{14} unabhängig voneinander C_{1-8} -Alkyl, wobei Alkyl geradkettig oder verzweigt ist und unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, C_{3-8} -Cycloalkyl oder CH_2-C_{3-8} -Cycloalkyl, wobei Cycloalkyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, oder Phenyl, wobei Phenyl unsubstituiert oder ein- oder mehrfach substituiert ist, bedeuten.

6. Verwendung nach Anspruch 5, dadurch gekennzeichnet, daß

R^1 Methyl, n-Butyl, 1,1,3,3-Tetramethylbutyl, Benzyl, 2-Chlorbenzyl, 2-Methoxybenzyl, $CH_2CO_2CH_3$, $(CH_2)_6-NC$, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, 2,6-Dimethylphenyl, 3-Chlorphenyl oder 3-Chlor-4-fluorphenyl bedeutet,

R^2 H oder $C(=O)CH_3$ bedeutet,

R^3 Methyl, tert-Butyl, Cyclohexyl, Phenyl, 2-Methylphenyl, 3-Methylphenyl, 4-Methylphenyl, 2-Trifluormethylphenyl, 3-Trifluormethylphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 2-Hydroxyphenyl, 2-Methoxyphenyl, 3-Hydroxyphenyl, 3-Methoxyphenyl, 2-Fluorphenyl, 3-Fluorphenyl, 4-Fluorphenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, 2-Bromphenyl, 3-Bromphenyl, 4-Bromphenyl, 2-Nitrophenyl, 3-Nitrophenyl, 4-Nitrophenyl, 3-(4-Chlorphenoxy)-phenyl, 2,4-Dimethylphenyl, 2,3-Dimethoxyphenyl, 3,4-Dimethoxyphenyl, 3-Methoxy-4-acetoxyphenyl, 2,3-Dichlorphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 2-Chlor-

- 5 4-fluorphenyl, 2-Chlor-6-fluorphenyl, 4-Brom-2-fluorphenyl, 3,4,5-Trimethoxyphenyl, 1-Naphthyl, 2-Ethoxy-naphth-1-yl, 4-Dimethylamino-naphth-1-yl, 9-Phenanthrenyl, Pyrrol-2-yl, N-Methylpyrrol-2-yl, Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, Furan-2-yl, Furan-3-yl, 5-Methyl-furan-2-yl, 4,5-Dimethyl-furan-2-yl, 5-Hydroxymethyl-furan-2-yl, 5-Acetoxymethyl-furan-2-yl, 5-Carboxy-furan-2-yl, 5-[1,3]-Dioxolan-furan-2-yl, 3-Brom-furan-2-yl, 5-Brom-furan-2-yl, 5-Nitro-furan-2-yl, 5-(2-Nitrophenyl)-furan-2-yl, 5-(2-Chlorphenyl)-furan-2-yl, 5-(3-Chlorphenyl)-furan-2-yl, 5-(3-Chlorphenyl)-furan-3-yl, 5-(4-Chlorphenyl)-furan-2-yl, Benzo[b]furan-2-yl, Thien-2-yl, Thien-3-yl, 5-Methyl-thien-2-yl, 5-Carboxy-thien-2-yl, 3-Brom-thien-2-yl, 5-Chlor-thien-2-yl oder 5-Methylsulfanyl-thien-2-yl bedeutet,
- 10 R^4 H, CH_3 , Cl, Br oder CO_2H bedeutet,
- 15 R^5 H, CH_3 , C_2H_5 oder Cl bedeutet,
- R^6 H, CH_3 , Cl, Br oder NO_2 ,
- R^7 H, CH_3 oder $n-C_3H_7$ bedeutet und
- R^8 $C(=O)CH_3$ bedeutet.
- 20 7. Verwendung nach Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, daß R^4 und R^6 H bedeuten, R^5 H, CH_3 oder C_2H_5 bedeutet und R^7 H oder CH_3 bedeutet.
- 25 8. Verwendung nach einem der Ansprüche 1, 2 oder 3, dadurch gekennzeichnet, daß die Verbindung der allgemeinen Struktur I aus der Gruppe ausgewählt ist, die enthält:
- 30 *tert*-Butyl-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(5,7-Dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,

- {6-[5,7-Dimethyl-2-(1H-pyrrol-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
tert-Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
5 [2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin;
(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
10 (1,1,3,3-Tetramethyl-butyl)-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-
yl)-amin,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
amin,
15 (5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
Cyclohexyl-[7-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-
a]pyridin-3-yl]-amin,
tert-Butyl-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
20 (7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
amin,
[2-(2-Fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-
25 tetramethyl-butyl)-amin,
(2,7-Dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-
essigsäuremethylester,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-
ylamino)-hexyl]-ammonium,
30 3-(3-*tert*-Butylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol,
Cyclohexyl-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
amin,

- tert*-Butyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
3-(3-*tert*-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol,
tert-Butyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
5 Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
amin,
Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
amin,
(2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-
10 tetramethyl-butyl)-amin,
(7-Methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
Butyl-(2-cyclohexyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
3-[5,7-Dimethyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-
15 a]pyridin-2-yl]-phenol,
(2,6-Dimethyl-phenyl)-(5,7-dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-
yl)-amin,
tert-Butyl-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
amin,
20 (2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-fluor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-
a]pyridin-3-yl]-amin,
Cyclohexyl-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
[5,7-Dimethyl-2-(1H-pyrrol-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
25 Butyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(5,7-Dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-
dimethyl-phenyl)-amin,
30 (2,7-Dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-
amin,

- [2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
5 (2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[6-(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,
10 (7-Methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
15 [2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
20 *tert*-Butyl-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
Essigsäure 5-(3-cyclohexylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-ylmethylester,
25 [2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
3-(3-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol,
30 (2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,

- (2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
Essigsäure 5-(3-cyclohexylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-ylmethylester,
5 [6-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methyldiäthylammonium,
Butyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
{6-[2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methyldiäthylammonium,
10 {5-[5,7-Dimethyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-yl}-methanol,
(7-Methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
15 [5-(3-*tert*-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-yl]-methanol,
tert-Butyl-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
20 5-(3-*tert*-Butylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-carbonsäure,
tert-Butyl-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Cyclohexyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
25 [2-(2,3-Dichlorphenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
(7-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
(2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
30 3-(3-Butylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-phenol,

- Butyl-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
{6-[5,7-Dimethyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
5 *tert*-Butyl-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Cyclohexyl-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
[2-(2,3-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
10 (2,6-Dimethyl-phenyl)-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
{2-[5-(2-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
5-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure,
15 Cyclohexyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
3-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-phenol,
20 [2-(2,3-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,4-Dichlorphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(5-Bromfuran-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
25 5-(3-Cyclohexylamino-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-carbonsäure,
[6-(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,
30 [2-(2,4-Dichlorphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,

- (2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
5-(3-Cyclohexylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-furan-2-carbonsäure,
5 {6-[2-(2-Bromphenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
tert-Butyl-(2-cyclohexyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
tert-Butyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
10 (5,7-Dimethyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,3-Dichlorphenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
15 {2-[5-(3-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
Cyclohexyl-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
[2-(2-Bromphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-cyclohexyl-amin,
20 [2-(2-Methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
{5-[7-Methyl-3-(1,1,3,3-tetramethyl-butylamino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-yl}-methanol.
25 (6-{2-[5-(2-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino}-hexyl)-methylidyne-ammonium,
Cyclohexyl-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
Cyclohexyl-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
30 [6-(5,7-Dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,

- Methylidyne-[6-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
5 {6-[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
5-(3-*tert*-Butylamino-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure,
Cyclohexyl-(8-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
10 [2-(2,3-Dichlor-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
5-(3-Butylamino-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure,
Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
15 (2-Benzofuran-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
{6-[2-(2-Fluor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-
20 (1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-phenanthren-9-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
5-(3-*tert*-Butylamino-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure,
25 *tert*-Butyl-(8-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
Methylidyne-[6-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-ammonium,
tert-Butyl-(2-cyclohexyl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
30 (6-Methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
tert-Butyl-(6-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,

- (7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
5-(3-*tert*-Butylamino-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl)-thiophen-2-carbonsäure,
5 [6-(5,7-Dimethyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,
3-[3-(2,6-Dimethyl-phenylamino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-phenol,
(2,6-Dimethyl-phenyl)-(8-methyl-2-*o*-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
10 {6-[2-(3-Hydroxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
{5-[3-(2,6-Dimethyl-phenylamino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-furan-2-yl}-methanol,
15 (8-Methyl-2-*p*-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
[2-(2,4-Dichlorphenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2,6-dimethyl-phenyl)-amin,
Butyl-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
20 Butyl-[2-(4-dimethylamino-naphthalen-1-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-amin,
{6-[2-(2-Brom-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
25 Butyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
(2-Cyclohexyl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
30 Cyclohexyl-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-ylamino)-essigsäuremethylester,

- N-(2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
5 N-*tert*-Butyl-N-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid
N-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-(5,7-Dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
10 N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(5,7-dimethyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
N-(2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
15 N-(1,1,3,3-Tetramethyl-butyl)-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
20 5-[3-(Acetyl-*tert*-butyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure,
5-[3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure,
N-[2-(5-Hydroxymethyl-furan-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
25 N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(2-cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
30 Essigsäure 5-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethyl ester,

- {6-[Acetyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
5 N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid,
N-(5,7-Dimethyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
10 N-Cyclohexyl-N-[7-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-(6,8-Dibrom-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
15 N-(7-Methyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
Essigsäure-5-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethylester,
N-(7-Methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
20 N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-[5,7-dimethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
25 N-Butyl-N-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-[5,7-dimethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
30 [Acetyl-(2,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-essigsäuremethylester,

- N-Cyclohexyl-N-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-a]pyridin-
2-yl}-thiophen-2-carbonsäure,
N-[2-(2,4-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-
5 (1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-
3-yl]-acetamid,
N-(2-*tert*-Butyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-
dimethyl-phenyl)-acetamid,
10 N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-
imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-[2-(3-Hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-
(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-fluor-phenyl)-5,7-dimethyl-
15 imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
5-[3-(Acetyl-*tert*-butyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-
thiophen-2-carbonsäure,
N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-
imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
20 N-(7-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-
tetramethyl-butyl)-acetamid,
5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-7-methyl-imidazo[1,2-
a]pyridin-2-yl}-furan-2-carbonsäure,
N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
25 acetamid,
N-[2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-
a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-
dimethyl-phenyl)-acetamid,
30 N-*tert*-Butyl-N-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-
acetamid,

- N-*tert*-Butyl-N-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- N-Cyclohexyl-N-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 5 N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- N-[2-(2,3-Dimethoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- 10 N-[2-[3-(4-chlor-phenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
- N-[2-(5-[1,3]Dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- 5-[3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure,
- 15 N-*tert*-Butyl-N-[7-methyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- N-[2-(5-Methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- 20 5-[3-(Acetyl-*tert*-butyl-amino)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-carbonsäure,
- N-[2-(4,5-Dimethyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- 25 N-Cyclohexyl-N-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- N-*tert*-Butyl-N-(7-methyl-2-naphthalen-1-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 5-[3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-a]pyrazin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure,
- 30 N-Butyl-N-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-acetamid,

- N-[2-(3,4-Dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-(7-methyl-2-phenanthren-9-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
5 N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2-fluor-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-[2-(2-Methoxy-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
10 N-(2-*tert*-Butyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
Essigsäure-4-{3-[acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-6-brom-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-2-methoxy-phenylester,
15 N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
[6-(Acetyl-[7-methyl-2-[5-(2-nitro-phenyl)-furan-2-yl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino)-hexyl]-methylidyne-ammonium,
N-(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
20 N-(2-Benzofuran-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
5-[3-(Acetyl-*tert*-butyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure,
25 N-(2-Cyclohexyl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
30 N-[2-(4,5-Dimethyl-furan-2-yl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,

- N-Butyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
N-[2-(3-Brom-thiophen-2-yl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid,
5 5-{3-[Acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-thiophen-2-carbonsäure,
N-Butyl-N-[2-(2,3-dimethoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
10 N-(2-Furan-2-yl-5-propyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
5-[3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure,
15 5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-furan-2-carbonsäure,
3-(Acetyl-butyl-amino)-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-8-carbonsäure,
{6-[Acetyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
20 N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-acetamid,
5-[3-(Acetyl-cyclohexyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-thiophen-2-carbonsäure,
25 N-[2-(5-Methylsulfanyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-[2-(2,3-Dichlor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
N-Butyl-N-[2-(2-methoxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
30 (6-{Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-6-nitro-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino}-hexyl)-methylidyne-ammonium,

- N-(2-Benzofuran-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
(6-{Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino}-hexyl)-methyldiylne-ammonium,
5 {6-[Acetyl-(7-methyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methyldiylne-ammonium,
N-(6-Methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
Essigsäure-5-{3-[acetyl-(2,6-dimethyl-phenyl)-amino]-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-furan-2-ylmethylester,
10 {Acetyl-[2-(3-hydroxy-phenyl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino}-essigsäuremethylester,
N-tert-Butyl-N-[2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
15 N-Butyl-N-[2-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-[2-(2,4-Dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-acetamid,
5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl}-furan-2-carbonsäure,
20 Essigsäure-5-{3-[acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl}-furan-2-ylmethylester,
N-(2,7-Dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
25 Essigsäure-4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5-amino-7-chlor-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenylester,
Essigsäure-4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenylester,
N-[6-Brom-2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid,
30 N-[2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid,

- N-Butyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
- N-[2-(5-chlor-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
- 5 [Acetyl-(2-cyclohexyl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-essigsäuremethylester,
- N-*tert*-Butyl-N-[2-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- N-Cyclohexyl-N-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- 10 Essigsäure-5-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl]-furan-2-ylmethylester,
- N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[6-methyl-2-(2-trifluormethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- 15 N-Cyclohexyl-N-(2-furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- N-Cyclohexyl-N-[2-(5-[1,3]dioxolan-2-yl-furan-2-yl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- 20 N-*tert*-Butyl-N-(5-propyl-2-pyridin-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
- N-*tert*-Butyl-N-[2-(5-methyl-thiophen-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
- 25 3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-8-carbonsäure,
- N-*tert*-Butyl-N-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
- N-[2-[3-(4-chlor-phenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid,
- 30 Essigsäure-4-[3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-2-yl]-2-methoxy-phenylester,

- N-[2-(5-Brom-furan-2-yl)-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
5 N-Cyclohexyl-N-[2-(2,3-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-Cyclohexyl-N-[2-(2,4-dichlor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
10 [Acetyl-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl)-amino]-essigsäuremethylester,
N-*tert*-Butyl-N-(6,8-dichlor-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
15 N-*tert*-Butyl-N-(5-propyl-2-thiophen-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
{6-[Acetyl-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
N-Butyl-N-(6-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
20 (6-{Acetyl-[2-(2-methoxy-phenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amino}-hexyl)-methylidyne-ammonium,
5-{3-[Acetyl-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amino]-6-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-2-yl}-furan-2-carbonsäure,
N-Butyl-N-[2-(3,4,5-trimethoxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-acetamid,
25 N-Butyl-N-[2-(3-hydroxy-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl]-acetamid,
[Acetyl-(2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-amino]-essigsäuremethylester,
30 N-(2-Benzofuran-2-yl-8-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-N-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-acetamid,
N-Butyl-N-(7-methyl-2-p-tolyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-acetamid,

- N-*tert*-Butyl-N-(6,8-dibrom-2-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid,
{6-[Acetyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amino]-hexyl}-methylidyne-ammonium,
5 N-*tert*-Butyl-N-[2-(2-ethoxy-naphthalen-1-yl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
N-*tert*-Butyl-N-[2-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid,
Cyclohexyl-[7-methyl-2-(2-trifluoromethyl-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin-Hydrochlorid,
10 *tert*-Butyl-(2-furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
tert-Butyl-(7-methyl-2-phenyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
Cyclohexyl-(5,7-dimethyl-2-pyridin-4-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
15 (2-Furan-2-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
tert-Butyl-(2,5,7-trimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid
20 [2-(2-Fluorphenyl)-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
Cyclohexyl-(7-methyl-2-phenyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid;
(2-Furan-2-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
25 *tert*-Butyl-[2-(4-nitro-phenyl)-imidazo[1,2-a]pyrazin-3-yl]-amin-Hydrochlorid,
N-[2-[3-(4-Chlorphenoxy)-phenyl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-N-cyclohexyl-acetamid-Hydrochlorid,
30 N-Cyclohexyl-N-(7-methyl-2-o-toly-2-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-acetamid-Hydrochlorid,

- N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-[2-(2,4-dimethyl-phenyl)-5-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-acetamid-Hydrochlorid,
1-Acetyl-3-(acetyl-cyclohexyl-amino)-7-methyl-2-o-tolyl-imidazo[1,2-a]pyridin-1-ium-Chlorid-Hydrochlorid,
5 Cyclohexyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
Cyclopentyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
[2-(4-Bromo-2-fluoro-phenyl)-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-cyclopentyl-amin-Hydrochlorid,
10 Cyclopentyl-{5,7-dimethyl-2-[5-(2-nitro-phenyl)-furan-2-yl]-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amin-Hydrochlorid,
{2-[5-(4-Chlorphenyl)-furan-2-yl]-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-cyclopentyl-amin-Hydrochlorid,
15 Cyclopentyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
(2-Furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
Benzyl-(7-methyl-2-thiophen-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
20 Cyclohexyl-(2-furan-3-yl-5,7-dimethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin-Hydrochlorid,
(2-Furan-3-yl-7-methyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
25 (5,7-Dimethyl-2-thiophen-3-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amin-Hydrochlorid,
[7-Ethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2-methoxy-benzyl)-amin,
(2-Chlorbenzyl)-[7-ethyl-2-(5-nitro-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
30 [7-Ethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-(2-methoxy-benzyl)-amin,

- (2-Chlorbenzyl)-(7-ethyl-2-furan-2-yl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-amin,
(3-Chlor-4-fluorphenyl)-[7-ethyl-2-(5-methyl-furan-2-yl)-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin,
(2-Benzofuran-2-yl-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(3-chlor-4-fluorphenyl)-amin,
5 (2-Benzofuran-2-yl-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)-(3-chlorphenyl)-amin,
(3-Chlor-4-fluorphenyl)-{2-[5-(3-chloro-phenyl)-furan-2-yl]-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amin,
10 (3-Chlor-4-fluorphenyl)-{2-[5-(2-chlorphenyl)-furan-2-yl]-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl}-amin,
(3-Chlor-4-fluorphenyl)-[2-(4,5-dimethyl-furan-2-yl)-7-ethyl-imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]-amin.

15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP 01/11701

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 A61K31/4985 A61K31/519

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BIOSIS, EMBASE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	WO 01 27109 A (MAUL CORINNA ;GERLACH MATTHIAS (DE); GRUENENTHAL GMBH (DE); HENNIE) 19 April 2001 (2001-04-19) abstract page 10, line 23 page 4, line 5 - line 18	1-5,8
E	WO 02 02557 A (NEUROGEN CORP ;CAI GUOLIN (US); SHAW KENNETH (US)) 10 January 2002 (2002-01-10) page 6, line 1 -page 8, line 10 page 4, line 15 - line 16	1,3
X	US 4 450 164 A (BRISTOL JAMES A ET AL) 22 May 1984 (1984-05-22) abstract column 1, line 16 - line 56 column 2; example 5	1,3-7
-/--		



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

G document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

12 March 2002

Date of mailing of the international search report

03/04/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Giacobbe, S

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 01/11701

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	FR 2 638 161 A (CENTRE NAT RECH SCIENT) 27 April 1990 (1990-04-27) the whole document ---	1-8
A	MURAD F: "Discovery of Some of the Biological Effects of Nitric Oxide and Its Role in Cell Signalling (Nobel Lecture)" ANGEWANDTE CHEMIE. INTERNATIONAL EDITION, VERLAG CHEMIE. WEINHEIM, DE, vol. 38, 1999, pages 1856-1868, XP002159759 ISSN: 0570-0833 the whole document page 1865, column 1, line 1 table 6 ---	1-8
A	BIENAYME H ET AL: "A NEW HETEROCYCLIC MULTICOMPONENT REACTION FOR THE COMBINATORIAL SYNTHESIS OF FUSED 3-AMINOIMIDAZOLES" ANGEWANDTE CHEMIE. INTERNATIONAL EDITION, VERLAG CHEMIE. WEINHEIM, DE, vol. 37, no. 16, 1998, pages 2234-2237, XP000978871 ISSN: 0570-0833 the whole document ---	1-8
X	BLACKBURN, C., ET AL.: "Parallel Synthesis of 3-Aminoimidazo[1,2-a]pyridines and pyrazines by a New Three-Component Condensation" TETRAHEDRON LETT., vol. 39, 1998, pages 3635-3638, XP002192771 page 3635, line 3, paragraph 2 -----	1-7

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/11701

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0127109	A	19-04-2001	DE 19948434 A1	07-06-2001
			AU 7419900 A	23-04-2001
			AU 7519900 A	23-04-2001
			AU 7777100 A	23-04-2001
			AU 7777200 A	23-04-2001
			AU 7915300 A	23-04-2001
			WO 0127110 A2	19-04-2001
			WO 0127111 A2	19-04-2001
			WO 0127118 A2	19-04-2001
			WO 0127119 A2	19-04-2001
			WO 0127109 A2	19-04-2001
WO 0202557	A	10-01-2002	WO 0202557 A2	10-01-2002
US 4450164	A	22-05-1984	US 4507294 A	26-03-1985
			AT 18402 T	15-03-1986
			AU 556062 B2	23-10-1986
			AU 8517882 A	06-01-1983
			CA 1248957 A1	17-01-1989
			DE 3269604 D1	10-04-1986
			DK 284482 A	27-12-1982
			EP 0068378 A1	05-01-1983
			ES 513431 D0	01-08-1983
			ES 8307806 A1	01-11-1983
			FI 822266 A ,B,	27-12-1982
			GR 74924 A1	12-07-1984
			HU 189595 B	28-07-1986
			IE 53324 B1	12-10-1988
			JP 1718718 C	14-12-1992
			JP 4004318 B	27-01-1992
			JP 58013584 A	26-01-1983
			KR 8801718 B1	08-09-1988
			MY 62487 A	31-12-1987
			NO 822128 A ,B,	27-12-1982
			NZ 201066 A	16-08-1985
			OA 7130 A	31-03-1984
			PH 20432 A	05-01-1987
			PT 75115 A ,B	01-07-1982
			ZA 8204516 A	29-02-1984
			CA 1202630 A1	01-04-1986
FR 2638161	A	27-04-1990	FR 2638161 A1	27-04-1990

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/11701

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 A61K31/4985 A61K31/519

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BIOSIS, EMBASE

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,X	WO 01 27109 A (MAUL CORINNA ;GERLACH MATTHIAS (DE); GRUENENTHAL GMBH (DE); HENNIE) 19. April 2001 (2001-04-19) Zusammenfassung Seite 10, Zeile 23 Seite 4, Zeile 5 - Zeile 18	1-5,8
E	WO 02 02557 A (NEUROGEN CORP ;CAI GUOLIN (US); SHAW KENNETH (US)) 10. Januar 2002 (2002-01-10) Seite 6, Zeile 1 -Seite 8, Zeile 10 Seite 4, Zeile 15 - Zeile 16	1,3
X	US 4 450 164 A (BRISTOL JAMES A ET AL) 22. Mai 1984 (1984-05-22) Zusammenfassung Spalte 1, Zeile 16 - Zeile 56 Spalte 2; Beispiel 5	1,3-7
-/--		

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E Älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann nahelegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

12. März 2002

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

03/04/2002

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5618 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Giacobbe, S

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/11701

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	FR 2 638 161 A (CENTRE NAT RECH SCIENT) 27. April 1990 (1990-04-27) das ganze Dokument ---	1-8
A	MURAD F: "Discovery of Some of the Biological Effects of Nitric Oxide and Its Role in Cell Signalling (Nobel Lecture)" ANGEWANDTE CHEMIE. INTERNATIONAL EDITION, VERLAG CHEMIE. WEINHEIM, DE, Bd. 38, 1999, Seiten 1856-1868, XP002159759 ISSN: 0570-0833 das ganze Dokument Seite 1865, Spalte 1, Zeile 1 Tabelle 6 ---	1-8
A	BIENAYME H ET AL: "A NEW HETEROCYCLIC MULTICOMPONENT REACTION FOR THE COMBINATORIAL SYNTHESIS OF FUSED 3-AMINOIMIDAZOLES" ANGEWANDTE CHEMIE. INTERNATIONAL EDITION, VERLAG CHEMIE. WEINHEIM, DE, Bd. 37, Nr. 16, 1998, Seiten 2234-2237, XP000978871 ISSN: 0570-0833 das ganze Dokument ---	1-8
X	BLACKBURN, C., ET AL.: "Parallel Synthesis of 3-Aminoimidazo[1,2-a]pyridines and pyrazines by a New Three-Component Condensation" TETRAHEDRON LETT., Bd. 39, 1998, Seiten 3635-3638, XP002192771 Seite 3635, Zeile 3, Absatz 2 -----	1-7

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/11701

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0127109	A	19-04-2001	DE 19948434 A1	07-06-2001
			AU 7419900 A	23-04-2001
			AU 7519900 A	23-04-2001
			AU 7777100 A	23-04-2001
			AU 7777200 A	23-04-2001
			AU 7915300 A	23-04-2001
			WO 0127110 A2	19-04-2001
			WO 0127111 A2	19-04-2001
			WO 0127118 A2	19-04-2001
			WO 0127119 A2	19-04-2001
			WO 0127109 A2	19-04-2001
WO 0202557	A	10-01-2002	WO 0202557 A2	10-01-2002
US 4450164	A	22-05-1984	US 4507294 A	26-03-1985
			AT 18402 T	15-03-1986
			AU 556062 B2	23-10-1986
			AU 8517882 A	06-01-1983
			CA 1248957 A1	17-01-1989
			DE 3269604 D1	10-04-1986
			DK 284482 A	27-12-1982
			EP 0068378 A1	05-01-1983
			ES 513431 D0	01-08-1983
			ES 8307806 A1	01-11-1983
			FI 822266 A ,B,	27-12-1982
			GR 74924 A1	12-07-1984
			HU 189595 B	28-07-1986
			IE 53324 B1	12-10-1988
			JP 1718718 C	14-12-1992
			JP 4004318 B	27-01-1992
			JP 58013584 A	26-01-1983
			KR 8801718 B1	08-09-1988
			MY 62487 A	31-12-1987
			NO 822128 A ,B,	27-12-1982
			NZ 201066 A	16-08-1985
			OA 7130 A	31-03-1984
			PH 20432 A	05-01-1987
			PT 75115 A ,B	01-07-1982
			ZA 8204516 A	29-02-1984
			CA 1202630 A1	01-04-1986
FR 2638161	A	27-04-1990	FR 2638161 A1	27-04-1990